(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2003 年2 月13 日 (13.02.2003)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 03/011028 A1

(51) 国際特許分類⁷: A01N 37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C 237/40, 237/42, 257/06, C07D 239/88, 263/10, 265/08

(21) 国際出願番号:

PCT/JP02/07833

(22) 国際出願日:

2002年8月1日(01.08.2002)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2001-234100 2001 年8 月1 日 (01.08.2001) JP 特願2001-310308 2001 年10 月5 日 (05.10.2001) JP 特願 2001-334110

2001年10月31日(31.10.2001) JP

特願2002-156102 2002 年5 月29 日 (29.05.2002) JP

(71) 出願人 /米国を除く全ての指定国について): 日産化 学工業株式会社 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都 千代田区 神田錦町 3 丁目 7番地 1 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 沼田 昭 (NU-MATA,Akira) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県 船橋市 坪井町 7 2 2 番地 1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 前田 兼成 (MAEDA,Kazushige) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県 船橋市 坪井町 7 2 2 番地 1 日産

化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 三田猛志 (MITA,Takeshi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県 船橋市坪井町722番地1日產化学工業株式会社物質科学研究所内 Chiba (JP). 三宅 敏郎 (MIYAKE,Toshiro) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 瀧井新自 (TAKII,Shinji) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).伊藤 俊紀 (ITOH,Toshinori) [JP/JP]; 〒349-0294 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

- (74) 代理人: 津国肇 (TSUKUNI,Hajime); 〒105-0001 東京 都港区 虎ノ門1丁目22番12号 SVAX TSビ ル Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ 特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR,

/続葉有/

(54) Title: SUBSTITUTED AMIDES AND PEST CONTROLLERS

(54) 発明の名称: 置換アミド化合物及び有害生物防除剤

$$\mathbb{R}^{2^{N}} \mathbb{R}^{3}$$

$$W^2$$
 (\mathbb{R}^4)

G-1

G-2

(57) Abstract: Substituted amides represented by the general formula (1) or salts thereof; and pest controllers such as insecticides or acaricides, containing the same: (1) (G-1) (G-2) wherein A is a carbon atom or the like; G is a group represented by the general formula (G-1), (G-2), or the like; W¹ and W² are each independently oxygen or sulfur; X¹ is $-N(R^6)R^5$ or the like; X² is halogeno, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, or the like; Y¹, Y² and Y³ are each independently hydrogen, halogeno, cyano, or the like; R¹, R² and R³ are each independently cyano, C₁₋₁₂ alkyl, C₃₋₁₂ alkenyl, or the like; R⁴ is halogeno, cyano, nitro, or the like; R⁵ and R⁶ are each independently C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₆ alkenyl, or the like; m and n are each independently an integer of 1 to 3; and p3 is an integer of 1 to 4.

GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

本発明は、一般式(1):

$$(X^{2})_{m}$$
 R^{1}
 $(Y^{3})_{n}$
 $(X^{2})_{m}$
 $(X^{2}$

式中、A は炭素原子等を表し、G は G-1 又は G-2 等を表し、W 及び W は各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、X' は-N (R^6) R^6 等を表し、 X^2 はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル等を表し、Y'、 Y^2 及び Y^3 は各々独立して水素原子、ハロゲン原子又はシアノ等を表し、 R^1 、 R^2 及び R^3 は各々独立してシアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル等を表し、 R^4 はハロゲン原子、シアノ又はニトロ等を表し、 R^5 及び R^6 は各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニル等を表し、D 及び D は各々独立して D の整数を表し、D 3 は D 4 の整数を表す、

で表される置換アミド化合物又はその塩、及びそれらを含有する有害生物防除剤、特に殺虫剤又は殺ダニ剤を提供する。

明 細 書

置換アミド化合物及び有害生物防除剤

5 技術分野

本発明は、新規な置換アミド化合物及びその塩、並びに該化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤に関するものである。本発明における有害生物防除剤とは、農園芸分野、畜産分野及び衛生分野におけるあらゆる有害な生物を対象とした防除剤を意味する。また、本発明における農薬とは、農園芸分野における殺虫・殺ダニ剤、殺線虫剤、除草剤及び殺菌剤を意味する。

背景技術

10

15

20

- 有害生物防除剤、例えば殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来用いられてきた殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、既存の有害生物防除剤の一部のものは毒性が高く、或いはあるものは長期の残留性により、生態系を乱しつつある。このような状況下、低毒性かつ低残留性の新規な有害生物防除剤の開発が常に期待されている。
- 25 本発明者らは、上記の課題解決を目標に鋭意研究を重ねた結果、本発明に係る下記一般式(1)で表される新規な置換アミド化合物が優れた有害生物防除活性、特に殺虫殺 ダニ活性を示し、且つ、ホ乳動物、魚類及び益虫等の非標的生物に対してほとんど悪影響の無い、極めて有用な化合物であることを見い出し、本発明を完成した。

発明の開示

すなわち、本発明は下記〔1〕~〔12〕に関するものである。

[1] 一般式(1):

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{C} W^{1} \qquad (1)$$

式中、Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

5 Gは、G-1、G-2 又はG-3 を表し、

$$-\frac{W^{2}}{N-R^{3}}$$
 $-\frac{W^{2}}{N}$ $-(R^{4})_{p3}$ $-\frac{W^{2}}{N}$ $-(R^{4})_{p3}$ $-\frac{W^{2}}{N}$ $-\frac{(R^{4})_{p}}{N}$ $-\frac{(R^{4})_{p3}}{N}$ $-\frac{(R^{4})_$

W 及び W は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X¹は、X¹-1 又は X¹-2 を表し、

10

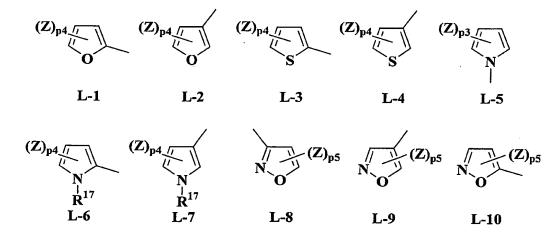
 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-15 SCN、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、-OH、 $-OR^8$ 、-SH、 $-S(0)_{r}R^8$ 、 $-S(0)_{2}0R^{10}$ 、 $-S(0)_{2}NHR^{11}$ 、 $-S(0)_{2}N(R^{11})R^{10}$ 、 $-NHR^9$ 、 $-N(R^9)R^8$ 、 $-CHO、-C(0)R^{10}$ 、 $-C(0)OR^{10}$ 、 $-C(0)SR^{10}$ 、 $-C(0)SR^{10}$ 、 $-C(0)NHR^{11}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)NHR^{11}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(H=NOR^{12})$ $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $-C(ENOR^{12})OR^{10}$ 、 $-C(ENOR^{12})SR^{10}$ 、 $-C(ENOR^{12})NHR^{11}$ 、 $-C(ENOR^{12})N(R^{11})R^{10}$ 、 $-P(0)(OR^{13})_2$ 、 $-P(S)(OR^{13})_2$ 、 $-P(0)(R^{14})(OR^{13})$ 、 $-Si(R^{15})(R^{16})R^{14}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいナフチル、 $(Z)_{p2}$ に同一であっても、または相異なっていてもよく、

更に Y¹、Y²及び Y³のうち、2つの Y が隣接する場合には、隣接する2つの Y は -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂N (R¹²) -, -CH₂CH₂ CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂-CH₂-, -N-CH₂-CH₂-, -N-CH₂-, -N-CH₂-CH₂-, -N-CH₂-CH₂-, -N-CH₂-, -N-

Lは、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、



Mは、式M-1から式M-28までの何れかで表される脂肪族複素環を表し、

$$(R^{19})_{q4} \longrightarrow (R^{19})_{q4} \longrightarrow (R^{19})_{q3} \longrightarrow (R^{19})_{q3$$

2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $O(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルスはフェニルを表し、 $O(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルスはフェニルを表し、 $O(C_1 \sim C_6)$ の名は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^1 、 R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された (R^{20}) R^{25} 、

15 -S (0) ₂N (R²⁸) R²⁷、-N (R²³) R²²、-C (0) R¹⁰、-C (0) 0R¹⁰、-C (0) SR¹⁰、-C (0) N (R²⁸) R²⁷、
-C (S) 0R¹⁰、-C (S) SR¹⁰ 又は M を表すか、或いは、R² と R³ とが一緒になって C₂~C₆ アルキレ

ルを表し、

ン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3\sim7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

- R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 R^{21} によって任意 に置換された $(C_1 \sim C_{10})$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルキニル、 $(C_2 \sim C_{10})$ アルキニル
- 10 -C (0) N (R¹¹) R¹⁰、-C (0) C (0) OR¹⁰、-CH=NOR¹²、-C (R¹⁰) =NOR¹²、-P (0) (OR¹³) ₂、-P (S) (OR¹³) ₂、-P (フェニル) ₂、-P (0) (フェニル) ₂、(Z) p₁ によって置換されていてもよいフェニル、(Z) p₂ によって置換されていてもよいナフチル、(Z) p6 によって置換されていてもよいビフェニル、L 又は M を表し、p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R⁴ は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、
- R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(0)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})_2R^{25}$ 、 $-S(0)_2N(R^{28})_2R^{27}$ 、-CHO、 $-C(0)_2R^{10}$ 、 $-C(0)_2R^{10}$ 、-

 R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_3$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_3$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_3$) アルキル、($C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$) アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキール、 $C_3 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim C_5$ アルケール、 $C_3 \sim C_5$ アルナール、 $C_3 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim C_5$ アルケール、 $C_3 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim C_5$ アルケール、 $C_3 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim C_5$ アルケール、 $C_3 \sim C_5$ アルキールスは ($C_1 \sim$

 R^{56} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

 R^6 は、(i) A が炭素原子を表すとき、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置

換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

さらに或いは、 R^6 が R^2 と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) -又は-C (O) C (R^{6a}) (R^{6b}) -を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する G 負又は G 負のヘテロ環を形成してもよいことを表し、

(i i) A が窒素原子を表すとき、 R^6 は R^2 と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) -又は-C (0) C (R^{6a}) (R^{6b}) - を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表し、

R^{6a}及びR^{6b}は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、R²¹によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表すか、或いは、R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ基によって任意に置換されていてもよく、

 R^7 は、ハロゲン原子、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、 $-OR^8$ 、-ON=C (R^{11}) R^{10} 、-SH、-S (O) $_rR^8$ 、 $-NHR^9$ 、-N (R^9) R^8 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 C_1 $\sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、-Si (R^{15}) (R^{16}) R^{14} 、(Z) $_{n1}$ によって置換されていてもよい

フェニル、(Z) p2 によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

 R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30}

によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) R^{10} R^{1

 R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_4 \sim C_6$ アルキール、 $C_1 \sim C_6$ アルキールカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基によって置換されていてもよく、

10

15

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス トルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス ルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シア ノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、トリメチルシリル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルナル、 $C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_4$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_1 \sim C_4$) フーアルキニル、($C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 10

又はMを表し、

25

 \mathbb{R}^{1} は、水素原子、 $\mathbb{C}_{1} \sim \mathbb{C}_{6}$ アルキル、 $\mathbb{C}_{1} \sim \mathbb{C}_{6}$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_{1} \sim \mathbb{C}_{6}$ ハロアルコキシ $\mathbb{C}_{1} \sim$ C_4) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ $P \mathcal{V} + \mathcal{V}$, $C_3 \sim C_8$ > 0 $P \mathcal{V} + \mathcal{V}$, $C_3 \sim C_6$ $P \mathcal{V} + \mathcal{V} + \mathcal{V}$, $C_3 \sim C_6$ $P \mathcal{V} + \mathcal{V} + \mathcal{V}$, $C_3 \sim C_6$ $P \mathcal{V} + \mathcal{V} + \mathcal{V} + \mathcal{V} + \mathcal{V}$, $C_3 \sim C_6$ $P \mathcal{V} + \mathcal$ ~C₆アルキニル又は C₃~C₆ハロアルキニルを表すか、或いは、R¹⁰と R¹¹とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成し てもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基 又は(Z)』によって置換されていてもよいフェニル基によって置換されていてもよく、

10 \mathbb{R}^{12} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ ニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル・ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルト・ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルト・ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルト・グ $(C_1 \sim C_4)$ アルト・ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルト・グ $(C_1 \sim C$ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって 15 $\sim C_4$) アルキル、L- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、M- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 C_3 ~C₆ハロアルキニル又は(Z)」によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R¹⁸は、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、

 R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよい フェニルを表し、 20

 R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 \mathbb{R}^{17} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{pl}$ によって置 換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニ ル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカ ルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよい フェニルを表し、

 \mathbb{R}^{18} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_7 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$

アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、 $(C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルギルアミノ $(C_1 \sim C_6)$ アルギルア $(C_1 \sim C_$

5

10

15

20

 R^{19} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルズニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルズニルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルスは($C_1 \sim C_6$ アルコキ

 R^{20} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノチオカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノチオカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルボニル・ $C_1 \sim C_6$ ハロアル・ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルボニル・ $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルボニル・ $C_1 \sim C_6$ ハロアル・ $C_1 \sim C_6$ ハロアル・

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、 $-OR^8$ 、-SH、-S (0) $_rR^{29}$ 、 $-NHR^9$ 、-N (R^9) R^8 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) OH、-C (0) OR^{10} 、-C (0) OH (0) OH (0) OH (1) OH

25 $-P(0)(0R^{13})_2$ 、 $-P(S)(0R^{13})_2$ 、 $-P(7x=n)_2$ 、 $-P(0)(7x=n)_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($(C_1\sim C_4)_2$)アルキル、 $(C_1\sim C_6)_2$ アルケニル、 $(C_3\sim C_6)_3$ アルキニル又は $(C_1\sim C_4)_2$ アルキル、 $(C_3\sim C_6)_3$ アルキニル又は $(C_1\sim C_4)_4$ アルキンのてもよいフェニルを表し、

 R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール・ $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキュール $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルトル $\mathbb{C}_6 \sim$

5

20

25

 R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 ($C_2 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル又は ($C_1 \sim C_1 \sim C_$

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 ($C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル又は ($C_1 \sim C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニルスは ($C_1 \sim C_2 \sim$

きこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、

且つ C₁~C₄アルキル基又は C₁~C₄アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、($C_2 \sim C_6$) によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、($C_2 \sim C_6$ アルコキシ、($C_3 \sim C_6$ アルコキシ、($C_4 \sim C_6$ アルコキシ、($C_5 \sim C_6$ アルコキシ ($C_5 \sim C_$

 R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫

黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよい

 R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、 $-OR^{32}$ 、-SH、-S (0) $_{\rm r}R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、-N (R^{33}) R^{32} 、-CHO、-C (0) R^{34} 、-C (0) OH、-C (0) OR^{34} 、-C (R^{34}) $=NOR^{12}$ 、 (Z) $_{\rm pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、 (Z) $_{\rm pl}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-0H、-0R³²、-SH、-S (0) $_{\rm r}$ R³²、-NHR³³、-N (R^{33}) R^{32} 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) 0R¹⁰、-C (1) 0R¹²、-C (1) 0R¹³ 0R¹⁴、-C (1) 0R¹⁵ 0R¹⁷、0R¹⁹ 0R¹⁹、0R¹⁹ 0R¹⁹、0R¹⁹ 0R¹⁹ 0R¹

 R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_6$) アルキル、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルカルボニル、 $Z_1 \sim Z_2$ アルキルアミノカルボニル、ジ($Z_1 \sim Z_2$ アルキル) アミノカルボニル、ジ($Z_1 \sim Z_3$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ($Z_1 \sim Z_4$ アルキル) アミノチオカルボニル、ジ($Z_1 \sim Z_5$ アルキル) アミノチオカルボニル、 $Z_1 \sim Z_5$ によって置換されていてもよいフェニル、($Z_1 \sim Z_5$ アルキル) アミノチオカルボニル、($Z_1 \sim Z_5$ アルキル

15

 R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキレスルホニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキレスルホニル、 $C_4 \sim C_6$ アルキレスルホニル、 $C_5 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチル基によって置換されていてもよく、

 R^{34} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 ($C_2 \sim C_6$ アルキル、 ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 ($C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 ($C_2 \sim C_6$ アルケニル、 ($C_2 \sim C_6$ アルナニル、 ($C_2 \sim C_6$ アルキニル、 ($C_2 \sim C_6$ アルキニル、 ($C_2 \sim C_6$ アルナンチル、 L 又は M を表し、

mは、 $1 \sim 3$ の整数を表し、

nは、 $1 \sim 3$ の整数を表し、

pは、1~6の整数を表し、

20 plは、1~5の整数を表し、

p2 は、1~7の整数を表し、

p3 は、1~4の整数を表し、

p4 は、1~3の整数を表し、

p5 は、1~2の整数を表し、

25 p6は、1~9の整数を表し、

q1 は、 $0 \sim 3$ の整数を表し、

q2は、0~5の整数を表し、

q3 は、0~7の整数を表し、

q4 は、0~9の整数を表し、

rは、 $0 \sim 2$ の整数を表す、

で表される置換アミド化合物又はその塩から選ばれる1種及び2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

- [2] 上記〔1〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以 5 上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。
 - 〔3〕 上記〔1〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。
 - [4] 上記[1]記載の一般式(1)で表される化合物において、 Aは、炭素原子を表し、
- Y^1 、 Y^2 及び Y^3 は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-SCN、-SF $_5$ 、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1\sim C_6)$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_3\sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2\sim C_6)$ アルケニル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2\sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2\sim C_6)$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2\sim C_6)$ アルキニル、
- -OH、 $-OR^8$ 、-SH、-S (0) $_2OR^{10}$ 、-S (0) $_2OR^{10}$ 、-S (0) $_2NHR^{11}$ 、-S (0) $_2N$ (R^{11}) R^{10} 、 $-NHR^9$ 、-N (R^9) R^8 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) R^{10} 、-C (0) R^{10} 、-C (0) R^{10} 、-C (1) R^{10} 、-C (2) R^{10} 、-C (2)
- 20 ていてもよいナフチル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、n が 2 以上 の整数を表すとき、各々の Y は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、 更に、n が 2 以上の整数であり、且つ 2 つの Y が隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N (R¹⁷) -, -CH₂N (R¹⁷) CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-
- 25 -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N (R¹⁷) CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N (R¹⁷) CH=N-, -N (R¹⁷) N=CH-, -CH=CHCH=CH-, -OCH₂CH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R¹⁸ によって任意に置換されていてもよく、

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよい置換アミド化合物又はその塩。

10 [5] 上記[1]記載の一般式(1)で表される化合物において、

Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

G は、G-1 を表し、

X¹は、X¹-1 を表し、

R² は R⁶ と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) -又は-C (O) C (R^{6a}) (R^{6b}) -を形成することにより、G 及 び X¹ が結合するベンゼン環と縮合する 6 員又は 7 員のヘテロ環を形成することを表す置 換アミド化合物又はその塩。

[6] 一般式(2):

$$(X^{2}) \xrightarrow{M^{1}} G$$

$$(Y^{1})_{n}$$

$$(Y^{3})_{n}$$

$$(Y^{3})_{n}$$

$$(Y^{3})_{n}$$

$$(Y^{3})_{n}$$

式中、Gは、G-1 又は G-2 を表し、

$$-\overset{W^{2}}{\overset{N-R^{3}}{\overset{R^{2}}{\overset{}}}} \qquad \overset{W^{2}}{\overset{}{\overset{}}} \qquad \overset{R^{4}}{\overset{}})_{p3}$$

W 及び W は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

20 X¹は、X¹-1 又は X¹-2 を表し、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

$$-N$$
 R^{5}
 $-N = C$
 R^{5a}
 $X^{1}-1$
 $X^{1}-2$

20

 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルカホニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル $(C_1 \sim$

15 -Si (R¹⁵) (R¹⁶) R¹⁴、 (Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-51、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-OR^{8a}$ 、 $-S(0)_{r}R^{8a}$ 、 $-S(0)_{2}OR^{10}$ 、 $-S(0)_{2}N(R^{11})R^{10}$ 、 $-N(R^9)R^{8b}$ 、 $-C(0)R^{10}$ 、 $-C(0)OR^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $-C(0)N(R^{11})R^{11}$ によって

25 Y³は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシン $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_$

5

10

15

 R^1 及び R^2 は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_2 \sim C_6$)シアノアルキル、($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_3 \sim C_6$ アルケニル、($C_3 \sim C_6$ アルキニル、($C_3 \sim C_6$ アルキニル、-SR²⁴、-S(0) C_2 R²⁴、-SN($C_3 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8 P N$ キル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8) P N$ キル、 $C_3 \sim C_8 > 0$ ロアルキル、ヒドロキシ $(C_3 \sim C_8) > 0$ ロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N$ コキシ $(C_3 \sim C_8) > 0$ ロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N$ キルスルフィニル $(C_3 \sim C_8) > 0$ ロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N$ キルスルフィニル $(C_3 \sim C_8) > 0$ ロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N$ キルスルフィニル $(C_3 \sim C_8) > 0$ ロアルキル、 $(C_3 \sim C_6) > 0$ ロアルキル、 $(C_3 \sim C_6) > 0$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_6) > 0$ アルキニル、 $(C_$

よく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 C_3 $\sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって固換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって固換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によって同様されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p3}$ によって可能を表し、 $(Z)_{p3}$ によってのなる によってのなる によっと、 $(Z)_{p3}$ によってのなる によっと、 $(Z)_{p3}$ によっての

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6 P$ ルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_6$ ア ルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキルカル ボニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキルカル ボニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_4$) アルキルカル ボニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_3 \sim C_6$ アルキール ($C_1 \sim C_6$ アルキルカル $C_$

20 R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル又は $(Z)_{pl}$ に よって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5b}は、C₁~C₆アルキルを表し、

25

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルキシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

 R^7 は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルメルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルカニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルカー $(C_1 \sim C$

 R^{8a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、-S (0) $_2$ R^{10} 、-P (0) (0 $R^{13})$ $_2$ 、-P (S) (0 $R^{13})$ $_2$ 、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-17、L-18、L-21、L-25、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

15 R^{8b}は、-C(0) R¹⁰又は-C(0) OR¹⁰を表し、

20

25

 R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル表し、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス トルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス ルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シア ノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、トリメチルシリル($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルナニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル・($C_3 \sim C_6$

 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結

WO 03/011028

合する窒素原子と共に $3\sim6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_3 \sim C_6$) クロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルカニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルカニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルカニルスルホニルスは $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (0) $_{1}R^{29}$ 、-N (R^{9}) R^{8c} 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C $(R^{10})=NOR^{12}$ 、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ ($C_1 \sim$

 \mathbb{R}^{22} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(\mathbb{C}_1$

~Ca) アルキルを表し、

WO 03/011028

15

 R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{25} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{27} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$) アルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ シアノアルキル、(\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル又は (\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって C_4 $\sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 ($(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p1}$ によって

45、L-48 又は L-49 を表し、

 \mathbb{R}^{30} は、ハロゲン原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキルチオ又は \mathbb{C}_1 によって置換されていてもよいフェニルを表し、

5 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $-OR^{32}$ 、-S (0) ${}_{r}R^{32}$ 、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 又は (Z) ${}_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

10 mは、1~3の整数を表し、

nは、 $1 \sim 3$ の整数を表し、

pは、1~4の整数を表す、

で表される上記〔4〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

〔7〕 一般式(3):

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{4})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{5})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{6})_{m} \xrightarrow{[]{}} (Y^{3})_{n}$$

15 式中、Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

20

·WI及びWIは、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、m が 2 以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコ

キシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルカニルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_2 \sim C_6)$ アルキニルオキシ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル)

24

 $-Si (R^{15}) (R^{16}) R^{14}$ 、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L、M-1、M-6、M-10、M-10 23 又は M-26 を表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-OR^{8a}$ 、 $-S(0)_{r}R^{8a}$ 、 $-S(0)_{r}QR^{10}$ 、 $-S(0)_{r}N(R^{11})R^{10}$ 、 $-N(R^9)R^{8b}$ 、 $-C(0)R^{10}$ 、 $-C(0)QR^{10}$ 、 $-C(0)QR^{10}$ 、 $-C(0)QR^{10}$ 、 $-C(0)QR^{10}$ 、 $-C(0)QR^{10}$ $-C(0)QR^{10}$

 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ 20 ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、-0-(L-17)、-0-(L-45)、-0-(L-48)、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルスルカイニル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $-C_1 \sim C_6$ アルキルスル $-C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $-C_1 \sim C_6$ アルキルスル $-C_1 \sim C_6$ アルキルスル

25 さらに Y¹、Y²及び Y³のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N (R¹⁷) -, -CH₂N (R¹⁷) CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂S-, -OCH=N-, -SCH=N-又は-N (R¹⁷) CH=N-を形成することにより、それぞれの Y が 結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 25

を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R¹⁸ によって任意に置換されていてもよく、

 R^1 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスル ホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアル キニル、 $C_3 \sim C_6$ アルコキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(0)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})$ R^{25} 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8 P$ ルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8) P$ ルキル、 $C_3 \sim C_8 > 0$ Pルキル、ヒドロキシ $(C_3 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $C_1 \sim C_4 P$ ルコキシ $(C_3 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $C_1 \sim C_4 P$ ルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $C_1 \sim C_4 P$ ルキルチオ $(C_3 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $(C_3 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $(C_4 \sim C_4 P)$ ルキル、 $(C_5 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $(C_5 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $(C_5 \sim C_8) > 0$ Pルキル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルケニル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルケニル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルキニル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルケニル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルキニル、 $(C_5 \sim C_8) P$ ルキン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $(C_5 \sim C_8) P$ $(C_5 \sim C_8)$

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア 置換されていてもよいフェニルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルナニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキールカル

ボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(0)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})R^{25}$ 、 $-S(0)_2N(R^{28})R^{27}$ 、-CHO、 $-C(0)R^{10}$ 、 $-C(0)OR^{10}$ 、 $-C(0)SR^{10}$ 、 $-C(0)N(R^{11})R^{10}$ 、 $-C(0)C(0)OR^{10}$ 、 $-C(S)OR^{10}$ 、 $-C(S)SR^{10}$ 、 $-C(S)N(R^{11})R^{10}$ 又は $(Z)_{01}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ヒドロキシアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキ シカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim$ C_6 アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル (C_1 $\sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{01}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ ア ルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ア 10 ルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、(Z) $_{11}$ によって置換されていてもよいフェニル、 L 又は M を表すか、或いは、 R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成するこ とにより、結合する炭素原子と共に3~6員環を形成してもよいことを表し、このとき このアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且 つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ 15 ハロアルコキシ基、 $C_i \sim C_6$ アルキルチオ基又は $C_i \sim C_6$ ハロアルキルチオ基によって任意に 置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^7 は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニ \mathbb{R}^7 ルオキシ、 \mathbb{R}^7 に $\mathbb{R$

 R^{8a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_8)$ アルケニル $(C_3 \sim C_8)$

-P (S) $(0R^{13})_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-17、L-18、L-21、L-25、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

R8bは、-C(0)R10又は-C(0)OR10を表し、

20

25

R⁹は、水素原子、C₁~C₅アルキル又はC₁~C₅ハロアルキル表し、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス トルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス ルホニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シア ノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、トリメチルシリル($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルナル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、 $C_3 \sim C_8$ アルキール、 $C_3 \sim C_8$ アルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキール・($C_3 \sim C_8$)

 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_3 \sim C_6$) アルキルを表し、 R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表

し、

10

20

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルメル フィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルカニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルカニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルスは $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (0) $_{r}R^{29}$ 、-N (R^9) R^{8c} 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C $(R^{10})=NOR^{12}$ 、(Z) $_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ ($C_1 \sim C$

15 -C (S) N (R¹¹) R¹⁰、-S (O) ${}_{2}$ R¹⁰、-S (O) ${}_{2}$ N (R¹¹) R¹⁰、-P (O) (OR¹³) ${}_{2}$ 、-P (S) (OR¹³) ${}_{2}$ 又は (Z) ${}_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{22} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4)$ アルキルを表し、

 \mathbb{R}^{23} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $-\mathbb{C}H0$ 、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $(\mathbb{Z})_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4)$ アルコキシカルボニル、 $(\mathbb{Z})_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(\mathbb{Z})_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は \mathbb{C}_1 によって置換されていてもよいフェニルを表し、

25 R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 負環を形成してもよいことを表し、このときこの

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

アルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つ C_1 $\sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{27} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ シアノアルキル、 (\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル又は (\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって C_4 $\sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5\sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、

15 (Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C (0) R¹⁰、-C (0) N (R¹¹) R¹⁰、
-C (S) N (R¹¹) R¹⁰、-P (0) (0R¹³)₂、-P (S) (0R¹³)₂、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニ
ル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $-OR^{32}$ 、-S (0) ${}_{1}R^{32}$ 、-C (0) ${}_{1}R^{10}$ 、-C (0) ${}_{1}R^{10}$ 、-C (0) ${}_{1}R^{10}$ 又は (2) ${}_{1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

nは、1~3の整数を表し、

10

nは、 $1 \sim 3$ の整数を表し、

0は、0又は1の整数を表す、

で表される上記[5]記載の置換アミド化合物又はその塩。

[8] ₩及び₩は、酸素原子を表し、

10

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6 P \mathcal{N} + \mathcal{$ 15 アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 C_1 $C_2 \sim C_6 \wedge C_7 \sim C_6 \wedge C_7 \sim C_6 \wedge C_7 \sim C_6 \wedge C_7 \sim C_7 \sim C_8 \wedge C_8 \wedge C_8 \sim C_8 \wedge C_8 \wedge C_8 \sim C_8 \wedge C_8$ 20 アルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されて いてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア ルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ 25 C_{4} ハロアルコキシ、 $(C_{1})_{n}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_{1} \sim C_{4})$ ハロアルコキ シ、C₃~C₈ハロシクロアルキルオキシ、C₇~C₆ハロアルケニルオキシ、C₁~C₆アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ $\wedge \Box P \wedge \nabla \Box P$ $\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{pl}$ によって置

換されていてもよいフェノキシ、-0-(L-47)、-0-(L-48)、-0-(L-48)、-0-(L-49)、 $C_1\sim C_6$

アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、-S-(L-17)、-S-(L-45)、-S-(L-48)、-S-(L-49)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、-N (\mathbb{R}^9) \mathbb{R}^{8b} 、-Si ($\mathbb{C}H_3$) ${}_2\mathbb{R}^{14}$ 、 $L-1\sim L-13$ 、L-15 ~L-35、 $L-37\sim L-58$ 又は M を表し、

 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルカフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルキの $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ か2 又は 3 を表すとき、各々の $C_1 \sim C_6$ か2 なば相異なっていてもよく、

さらに、 Y^3 が Y^1 又は Y^2 と隣接する場合には、隣接する 2 つの Y^1 と Y^3 又は Y^2 と Y^3 は $-CH_2CH_2O-$, $-CH_$

R1は、水素原子を表し、

5

10

15

 R^2 は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-3) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-4) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-45) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-46) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキニル・ $(C_1 \sim C_8)$ アルキニー $(C_1 \sim C_8)$ アルキニー

25 M-9、M-13、M-15、M-16、M-18、M-19、M-21、M-22、M-25 又は M-28 を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子 と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、 硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メチル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキルを表し、p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6 P$ ルキル、 $C_1 \sim C_6 N$ ロアルキル、 $C_3 \sim C_6 > D$ ロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルがボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキールカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 -S ($C_1 \sim C_6$ アルキールカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 -S ($C_1 \sim C_6$ アルキール・ $-SR^{25}$ 、 $-SR^{26}$ 、 $-SR^{26}$ 、 $-SR^{26$

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

20 R^{14} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (0) $_{r}R^{29}$ 、-N (R^{9}) R^{8c} 、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C $(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 \mathbb{R}^{8c} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$

20

33

 C_6 アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、-C (0) R^{10} 、-C (0) R^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、-C (S) N (R^{11}) R^{10} 、-S (0) ${}_3R^{10}$ 、

-S (0) $_2$ N (R^{11}) R^{10} 、-P (0) (OR^{13}) $_2$ 、-P (S) (OR^{13}) $_2$ 又は (Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、($C_1 \sim C_4$) ロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、($C_1 \sim C_4$) レフェニル、L 又は M を表し、

 $R^{"}$ は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 $R^{"0}$ と $R^{"1}$ とが一緒になって C_2 $\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されていてもよく、

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、

15 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル) アミノカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニルを表し、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 (Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C (0) R^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、

-C (S) N (R^{11}) R^{10} 、 (Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表す上記〔6〕記載の置換アミド化合物又はその塩。

[9] WI及びWIは、酸素原子を表し、

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のX²は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

5

10

15

20

25

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6 P \mathcal{N} + \mathcal{$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 C_1 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $(Z)_{ni}$ によって置換されて いてもよいベンジルオキシ(C₁~C₄)ハロアルキル、C₃~C₈ハロシクロアルキル、C₁~C₆ア ルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ C_4) ハロアルコキシ、 $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキ シ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ $\wedge \Box P \wedge \nabla = A \wedge A + b \wedge C_1 \sim C_6 \wedge \Box P \wedge \Box + b \wedge (C_2 \sim C_6) \wedge \Box P \wedge \nabla = A \wedge A + b \wedge C_1$ ~C₆アルキルスルホニルオキシ、C₁~C₆ハロアルキルスルホニルオキシ、(Z)₁₁によって置 換されていてもよいフェノキシ、-0-(L-17)、-0-(L-45)、-0-(L-48)、-0-(L-49)、C,~C。 アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₅~C₆ハロアルケニルチオ、(Z)_{n1}によって置換 されていてもよいフェニルチオ、-S-(L-17)、-S-(L-45)、-S-(L-48)、-S-(L-49)、C,~C。

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ

ルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なっていてもよく、

さらに Y¹、Y²及び Y³のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2C-$, $-CH_2C-$, $-CH_2$

10 -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂S-, -OCH=N-, -SCH=N-又は-N(R¹⁷) CH=N-を形成することにより、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁸によって任意に置換されていてもよく、

R1は、水素原子を表し、

20

25

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-3) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-4) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(L-45) - (C_1 \sim C_8)$ アルキニル、

(L-46) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノ、M-3、M-5、M-9、M-13、M-16、M-18、M-19、M-21、M-22、M-25 又は M-28 を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メチル基又はメトキシ基によって置換されていてもよく、

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル・ $C_1 \sim C_6$ アル

15

 R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

ルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル又は C₁~C₆ハロアルコキシカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{14} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、 \mathbb{R}^{17} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (O) $_rR^{29}$ 、-N (R^9) R^{8c} 、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、-C (O) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C $(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル・ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル・ $C_1 \sim C_4$ アルキ

-C (S) N (R^{11}) R^{10} 、-S (0) ${}_{2}R^{10}$ 、-S (0) ${}_{2}N$ (R^{11}) R^{10} 、-P (0) ($0R^{13}$) ${}_{2}$ 、-P (S) ($0R^{13}$) ${}_{2}$ 又は(Z) ${}_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、($C_1 \sim C_4$) いフェニル、L 又は M を表し、

R^{||}は、水素原子又は C₁~C₆アルキルを表すか、或いは、R^{||}と R^{||}とが一緒になって C₂

 $\sim C_{\mathfrak{s}}$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3\sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_{\mathfrak{s}}$ アルキル基によって置換されていてもよく、

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_3 \sim C_6$ アルケニルを表し、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C (0) R^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、-C (S) N (R^{11}) R^{10} 、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル又は ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル又は ($C_1 \sim C_6$ アルキル) 記載の置換アミド化合物又はその塩。

- 20 〔10〕 上記〔4〕ないし〔9〕記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる 1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。
 - [11] 上記[4]ないし[9]記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる 1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。
- [12] 上記[4]ないし[9]記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる 25 1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

発明を実施するための最良の形態

10

15

本発明に包含される化合物には、置換基の種類によっては E-体及び Z-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれら E-体、Z-体又は E-体及び Z-体を任意の割合で

10

含む混合物を包含するものである。また、本発明に包含される化合物のうちには、1個又は2個以上の不斉炭素原子の存在に起因する光学活性体が存在する場合があるが、本発明は全ての光学活性体又はラセミ体を包含する。さらに、本発明化合物は R^1 、 R^2 或いは R^3 が水素原子であるときに、場合によっては次式で表される互変異性体の存在が考えられるが、本発明はそれらの構造をも包含するものである。

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{1} \xrightarrow{G} (Y)_{m} \xrightarrow{X^{1}} (Y)_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{C} W^{1}$$

$$X^{1} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{C} W^{1}$$

$$X^{1} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{2} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{2} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{2} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{1} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

$$X^{2} \xrightarrow{H} (Y)_{n}$$

本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、燐酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマール酸、酒

石酸、蓚酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン

酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

10

或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にすることができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウムの塩とすることができる。

次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー及び t-はターシャリーを各々意味し、Ph はフェニルを意味する。

本発明化合物におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

本明細書における C。~C,アルキルの表記は、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は 分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル 15 基、n-ブチル基、s-ブチル基、i-ブチル基、t-ブチル基、n-ペンチル基、l-メチルブチ ル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、1,1-ジメチルプロ ピル基、1,2-ジメチルプロピル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、1-メチルペンチル 基、2-メチルペンチル基、3-メチルペンチル基、4-メチルペンチル基、1-エチルブチル 基、2-エチルブチル基、1,1-ジメチルプチル基、1,2-ジメチルブチル基、1,3-ジメチル 20 ブチル基、2,2-ジメチルブチル基、2,3-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基、 1, 1, 2-トリメチルプロピル基、1, 2, 2-トリメチルプロピル基、1-エチル-1-メチルプロピ. ル基、1-エチル-2-メチルプロピル基、ヘプチル基、1-メチルヘキシル基、5-メチルヘキ シル基、1,1-ジメチルペンチル基、2,2-ジメチルペンチル基、4,4-ジメチルペンチル基、 1-エチルペンチル基、2-エチルペンチル基、1,1,3-トリメチルブチル基、1,2,2-トリメ 25 チルブチル基、1,3,3-トリメチルブチル基、2,2,3-トリメチルブチル基、2,3,3-トリメ チルブチル基、1-n-プロピルブチル基、1,1,2,2-テトラメチルプロピル基、オクチル基、 1-メチルヘプチル基、3-メチルヘプチル基、6-メチルヘプチル基、2-エチルヘキシル基、 5,5-ジメチルヘキシル基、2,4,4-トリメチルペンチル基、1-エチル-1-メチルペンチル基、 ノニル基、1-メチルオクチル基、2-メチルオクチル基、3-メチルオクチル基、7-メチルオクチル基、1-エチルヘプチル基、1,1-ジメチルヘプチル基、6,6-ジメチルヘプチル基、デシル基、1-メチルノニル基、2-メチルノニル基、6-メチルノニル基、1-エチルオクチル基、1-n-プロピルヘプチル基、ウンデシル基、1-メチルデシル基、2-メチルデシル基、8-メチルデシル基、1-エチルノニル基、1-n-プロピルオクチル基、1-n-ブチルヘプチル基、ドデシル基、1-メチルウンデシル基、3-メチルウンデシル基、9-メチルウンデシル基、10-メチルウンデシル基、1-エチルデシル基、1-n-プロピルノニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

15

20

25

本明細書における C_a~C_bハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハ ロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は分岐鎖 状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場 合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっていてもよい。例 えばフルオロメチル基、クロロメチル基、プロモメチル基、ジフルオロメチル基、ジク ロロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、クロロジフルオロメチル 基、ブロモジフルオロメチル基、2-フルオロエチル基、1-クロロエチル基、2-クロロエ チル基、1-ブロモエチル基、2-ブロモエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、1,2-ジクロ ロエチル基、2、2-ジクロロエチル基、2-ブロモ-2-クロロエチル基、2、2、2-トリフルオロ エチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチル基、2-ブロモ-1, 1, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロ エチル基、2-クロロ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフル オロエチル基、2-ブロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチル基、2, 2-ジクロロ-1, 1, 2-トリ フルオロエチル基、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジフルオロエチル基、2-フルオロ-1-メチル エチル基、1-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロ-1-メチルエチル基、2-ブロモプロピル基、3-ブロモプロピル基、2-ブロモ-1-メチルエチ ル基、3-ヨードプロピル基、2,3-ジクロロプロピル基、2,3-ジブロモプロピル基、 3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、3, 3, 3-トリクロロプロピル基、3-ブロモ-3, 3-ジフルオ ロプロピル基、3,3-ジクロロ-3-フルオロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル 基、1-ブロモ-3、3、3-トリフルオロプロピル基、2、2、3、3、3-ペンタフルオロプロピル基、 1.1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチルエ

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

チル基、ヘプタフルオロプロピル基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエ チル基、2-ブロモ-1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピル基、2, 3-ジクロロ-1, 1, 2, 3, 3-ペンタフルオロプロピル基、2-クロロブチル基、3-クロロブチル基、4-クロロブチル基、 2-クロロ-1, 1-ジメチルエチル基、4-ブロモブチル基、3-ブロモ-2-メチルプロピル基、

2-ブロモ-1, 1-ジメチルエチル基、2, 2-ジクロロ-1, 1-ジメチルエチル基、2-クロロ-1-ク ロロメチル-2-メチルエチル基、4,4,4-トリフルオロブチル基、3,3,3-トリフルオロ-1-メチルプロピル基、3,3,3-トリフルオロ-2-メチルプロピル基、2,3,4-トリクロロブチル 基、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジメチルエチル基、4-クロロ-4,4-ジフルオロプチル基、

4, 4-ジクロロ-4-フルオロブチル基、4-ブロモ-4, 4-ジフルオロブチル基、2, 4-ジブロモ-4, 4-ジフルオロブチル基、3, 4-ジクロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル基、3, 3-ジクロロ-4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4-ブロモ-3, 3, 4, 4-テトラフルオロブチル基、4-ブロモ-3-クロロ-3, 4, 4-トリフルオロブチル基、2, 2, 3, 3, 4, 4-ヘキサフルオロブチル基、 2. 2. 3. 4. 4. 4-ヘキサフルオロブチル基、2. 2. 2-トリフルオロ-1-メチル-1-トリフルオロ

メチルエチル基、3,3,3-トリフルオロ-2-トリフルオロメチルプロピル基、 2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロブチル基、2, 3, 3, 3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチ 15 ルプロピル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基、4-クロロ-1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4-オクタフルオロブチル基、5-クロロペンチル基、3-クロロ-2. 2-ジメチルプロピル基、5-ブロモペンチル基、1. 5-ジブロモペンチル基、2. 3-ジブロ モ-1, 1-ジメチルプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロ-2-メチルブチル基、4, 4, 5, 5, 5-ペン タフルオロペンチル基、5-ブロモ-4, 4, 5, 5-テトラフルオロペンチル基、4, 4-ジクロロ-20 5. 5. 5-トリフルオロペンチル基、4. 5-ジクロロ-4, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-ブロ モ-4-クロロ-4, 5, 5-トリフルオロペンチル基、4, 4, 4-トリフルオロ-4-トリフルオロメチ ルブチル基、3, 3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘプタフルオロペンチル基、3, 4, 4, 4-テトラフルオロ-3-ト リフルオロメチルブチル基、2,3,3,4,4,4-ヘキサフルオロ-2-トリフルオロメチルブチル

基、2,4,5-トリクロロ-1,1,2,3,3,4,5,5-オクタフルオロペンチル基、6-クロロヘキシル 25 基、6-ブロモヘキシル基、4,4-ジクロロ-2,2-ジメチルブチル基、4,4,5,5,6,6,6-ヘプタ フルオロヘキシル基、4,5,5,5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチルペンチル基、

3.4.4.5.5.5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチルペンチル基、4.4.4-トリフルオロ-3, 3-ビストリフルオロメチルブチル基、1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6-ドデカフルオロヘキ WO 03/011028 PCT/JP02/07833 42

シル基、トリデカフルオロヘキシル基、6-クロロ-1, 1, 2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6-ドデカフルオロヘキシル基、7-ブロモヘプチル基、4, 5, 5, 6, 6-ヘキサフルオロ-4-トリフルオロメチルペンチル基、ペンタデカフルオロヘプチル基、8-クロロオクチル基、8-ブロモオクチル基、7, 7, 8, 8, 8-ペンタフルオロオクチル基、9-ブロモノニル基、9, 9, 9-トリフルオロノニル基、7, 8, 8, 8-テトラフルオロ-7-トリフルオロメチルオクチル基、10-クロロデシル基、10-ブロモデシル基、11-プロモウンデシル基、11, 11, 11-トリフルオロウンデシル基、12-ブロモドデシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シアノアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、シアノ基によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を表し、例えばシアノメチル基、1-シアノエチル基、2-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、1-シアノ-1-メチルエチル基、4-シアノブチル基、2-シアノー1、1-ジメチルエチル基、1-シアノ-1-メチルプロピル基、1-シアノ-1-エチルプロピル

10

15

20

25

本明細書における C_a~C_bシクロアルキルの表記は、炭素原子数が a~b 個よりなる環状 の炭化水素基を表し、3 員環から6 員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、シクロプチル基、1-メチルシクロプチル基、2,3,4-トリメチルシクロプチル基、シクロペンチル基、1-メチルシクロペンチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、1-エチルシクロペンチル基、2-エチルシクロペンチル基、3-エチルシクロペンチル基、1-エチルシクロペンチル基、1,2-ジメチルシクロペンチル基、1,3-ジメチルシクロペンチル基、2,2-ジメチルシクロペンチル基、1,3-ジメチルシクロペンチル基、2,2-ジメチルシクロペンチル基、3,4-ジメチルシクロペンチル基、2,4-ジメチルシクロペンチル基、3,4-ジメチルシクロペンチル基、2,3-ジメチルシクロペンチル基、3,4-ジメチルシクロペンチル基、2,4-ドリメチルシクロペンチル基、2,3,4-トリメチルシクロペンチル基、2,4,4-トリメチルシクロペンチル基、シクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキシル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル

シル基、1-エチルシクロヘキシル基、2-エチルシクロヘキシル基、4-エチルシクロヘキシル基、2,3-ジメチルシクロヘキシル基、2,4-ジメチルシクロヘキシル基、2,5-ジメチルシクロヘキシル基、3,3-ジメチルシクロヘキシル基、3,4-ジメチルシクロヘキシル基、3,5-ジメチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、5-ジメチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロハキシル基、5-ジメチルシクロハキシル基、4,4-ジメチルシクロハキシル基、シス-ビシクロ[3.1.0] ハキサン-2-イル基、ビシクロ[2.1.1] ハキサン-5-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3 員環から6 員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。

10

15

20

また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっていてもよい。例えば1-プロモシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジプロモシクロプロピル基、2,2-ジプロモシクロプロピル基、2,2-ジプロモンクロプロピル基、2,2-ジプロモンクロプロピル基、2,2-ジプロモー1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、1-プロモシクロブチル基、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル基、3,4-ジプロモシクロベンチル基、1-プロモシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、2-クロロシクロヘキシル基、3-クロロシクロヘキシル基、4-クロロシクロヘキシル基、2,2,6,6-テトラクロロシクロヘキシル基、1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-ウンデカフルオロシクロヘキシル基、2-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、3-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、3-トリフルオロメチルシクロヘキシル基、2-トリクロロメチルシクロヘキシル基、3,5-ジトリフルオロメチルシクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

25 本明細書における C_a~C_bアルケニルの表記は、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に 1 個又は 2 個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、1-メチルエテニル基、2-プロペニル基、1-ブテニル基、1-メチル-1-プロペニル基、2-メチル-1-プロペニル基、2-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、チル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、3-ブテニル基、1,3-ブタジエニル基、

44 1-ペンテニル基、1-メチル-1-ブテニル基、3-メチル-1-ブテニル基、1,2-ジメチル-1-プ ロペニル基、2-ペンテニル基、1-メチル-2-ブテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、3-メ チル-2-ブテニル基、1-エチル-2-プロペニル基、1、1-ジメチル-2-プロペニル基、1、2-ジ メチル-2-プロペニル基、3-ペンテニル基、1-メチル-3-ブテニル基、2-メチル-3-ブテニ ル基、3-メチル-3-ブテニル基、4-ペンテニル基、1,3-ペンタジエニル基、1-ビニル-2-プロペニル基、1-ヘキセニル基、1-メチル-1-ペンテニル基、1-(i-ブチル)エテニル基、 2-ヘキセニル基、2-メチル-2-ペンテニル基、1-エチル-2-ブテニル基、1,3-ジメチル-2-ブテニル基、1-プロピル-2-プロペニル基、1-(j-プロピル)-2-プロペニル基、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル基、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル基、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル基、3-ヘキセニル基、3-メチル-3-ペンテニル基、4-メチル-3-ペンテニル基、 1-エチル-3-ブテニル基、1.1-ジメチル-3-ブテニル基、1.2-ジメチル-3-ブテニル基、 1.3-ジメチル-3-ブテニル基、4-ヘキセニル基、1-メチル-4-ペンテニル基、3-メチル-4-ペンテニル基、4-メチル-4-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、1,5-ヘキサジエニル基、1-ビニル-3-ブテニル基、2.4-ヘキサジエニル基、1-ヘプテニル基、3-メチル-1-ヘキセニ ル基、2-エチル-1-ペンテニル基、2-ヘプテニル基、1,2-ジメチル-2-ペンテニル基、1-(i-プロピル) -2-ブテニル基、1-ブチル-2-プロペニル基、3-ヘプテニル基、1-(i-プロピ ル) -3-ブテニル基、1-エチル-1-メチル-3-ブテニル基、1-エチル-3-メチル-3-ブテニル 基、1, 1, 2-トリメチル-3-ブテニル基、1, 1, 3-トリメチル-3-ブテニル基、2, 2, 3-トリメ チル-3-ブテニル基、4-ヘプテニル基、1-エチル-4-ペンテニル基、1,1-ジメチル-4-ペン

10

15

20

25

ル-1-ビニル-3-ブテニル基、1,3,5-ヘプタトリエニル基、1-オクテニル基、2-オクテニル基、1-メチル-2-ヘプテニル基、2-エチル-2-ヘキセニル基、1-エチル-2-メチル-2-ペンテニル基、1-ペンチル-2-プロペニル基、2-ネオペンチル-2-プロペニル基、3-オクテニル基、1-(i-プロピル)-3-メチル-3-ブテニル基、1-エチル-1,2-ジメチル-3-ブテニル基、1-エチル-1,3-ジメチル-3-ブテニル基、1,5-ジメチル-4-ヘキセニル基、3,3,4-トリメチル-4-ペンテニル基、5-オクテニル基、3-メチル-5-ヘプテニル基、1,5-ジメチル-5-ヘキセニル基、7-オクテニル基、2,4-オクタジエニル基、2,7-オクタジエニル基、1-(2-

メチル-2-プロペニル)-2-ブテニル基、l-(i-プロペニル)-4-ペンテニル基、l-(i-プロペ

テニル基、1.3-ジメチル-4-ペンテニル基、1.4-ジメチル-4-ペンテニル基、2.2-ジメチ

ル-4-ペンテニル基、5-ヘプテニル基、6-ヘプテニル基、2.4-ヘプタジエニル基、3-メチ

ニル)-3-メチル-3-ブテニル基、1.1.4-トリメチル-2,4-ペンタジエニル基、5-メチル-2-メチレン-5-ヘキセニル基、1-ノネニル基、1-メチル-1-オクテニル基、2-ノネニル基、 1-(n-ヘキシル)-2-プロペニル基、3-ノネニル基、3-(ネオペンチル)-3-ブテニル基、 1.1.5-トリメチル-4-ヘキセニル基、7-メチル-5-オクテニル基、2.6-ジメチル-5-ヘプテ ニル基、4,4,5-トリメチル-5-ヘキセニル基、6-ノネニル基、8-ノネニル基、2,4-ノナジ エニル基、2.6-ノナジエニル基、3.6-ノナジエニル基、2.6-ジメチル-1.5-ヘプタジエニ ル基、2,4-ジメチル-2,6-ヘプタジエニル基、1,4-ジメチル-1,3,5-ヘプタトリエニル基、 1, 3-ジメチル-1, 4, 6-ヘプタトリエニル基、1-デセニル基、1, 2-ジメチル-1-オクテニル 基、4-デセニル基、2-(i-プロピル)-5-メチル-4-ヘキセニル基、1-エチル-1,5-ジメチ 10 ル-4-ヘキセニル基、1-エチル-3、3、4-トリメチル-4-ペンテニル基、5-デセニル基、5-エ チル-1,1-ジメチル-5-ヘキセニル基、3,7-ジメチル-6-オクテニル基、1,1,5-トリメチ ルー6-ヘプテニル基、7-デセニル基、3,7-ジメチル-7-オクテニル基、9-デセニル基、2-アリル-5-メチル-4-ヘキセニル基、1,1,4-トリメチル-2-ビニル-3-ペンテニル基、1-メ チレン-3-ノネニル基、2,4-デカジエニル基、1-メチル-1,3-ノナジエニル基、5,9-デカ 15 ジエニル基、1,5-ジメチル-1-ビニル-4-ヘキセニル基、3,7-ジメチル-2,6-オクタジエニ ル基、1-エチル-1,5-ジメチル-2,4-ヘキサジエニル基、1-(1-メチルエテニル)-4-メチ ル-3,5-ヘキサジエニル基、1-ウンデセニル基、2-ウンデセニル基、4-ウンデセニル基、 1, 3, 7-トリメチル-6-オクテニル基、10-ウンデセニル基、2, 4-ウンデカジエニル基、 5, 10-ウンデカジエニル基、2, 5, 8-ウンデカトリエニル基、1-ドデセニル基、2-ドデセニ 20 ル基、5-ドデセニル基、1-エチル-3、7-ジメチル-6-オクテニル基、7-ドデセニル基、1-エチル-3、7-ジメチル-7-オクテニル基、8-ドデセニル基、9-ドデセニル基、10-ドデセニ ル基、11-ドデセニル基、2.4-ドデカジエニル基、5.7-ドデカジエニル基、8,10-ドデカ ジエニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。 本明細書における C₂~C₅,ハロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、 ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は分岐 25

ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は分岐 鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。 このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原 子は互いに同一でも、または互いに相異なっていてもよい。例えば2-クロロビニル基、 2-ブロモビニル基、2-ヨードビニル基、2,2-ジクロロビニル基、2,2-ジプロモビニル基、

3-ブロモ-2-プロペニル基、1-クロロメチルビニル基、2-ブロモ-1-メチルビニル基、1-トリフルオロメチルビニル基、3,3,3-トリクロロ-1-プロペニル基、3-ブロモ-3,3-ジフ ルオロ-1-プロペニル基、2-クロロ-3、3、3-トリフルオロ-1-プロペニル基、2、3、3、3-テト ラクロロ-1-プロペニル基、1-トリフルオロメチル-2,2-ジフルオロビニル基、2-クロロ-2-プロペニル基、3.3-ジフルオロ-2-プロペニル基、3.3-ジクロロ-2-プロペニル基、 2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニル基、2, 3, 3-トリクロロ-2-プロペニル基、4-ブロモ-3-クロロ-3, 4, 4-トリフルオロ-1-ブテニル基、1-ブロモメチル-2-プロペニル基、3-クロ ロ-2-ブテニル基、4,4,4-トリフルオロ-2-ブテニル基、4-ブロモ-4,4-ジフルオロ-2-ブ テニル基、3-ブロモ-3-ブテニル基、4、4-ジフルオロ-3-ブテニル基、3、4、4-トリフルオ 10 ロ-3-ブテニル基、3, 4, 4-トリブロモ-3-ブテニル基、3-ブロモ-2-メチル-2-プロペニル 基、3,3,3-トリフルオロ-2-メチルプロペニル基、3-クロロ-4,4,4-トリフルオロ-2-ブテ ニル基、3,3,3-トリフルオロ-1-メチル-1-プロペニル基、3,3,5-トリフルオロ-2-トリフ ルオロメチル-1-プロペニル基、1,3,3,3-テトラフルオロ-2-トリフルオロメチル-1-プロ ペニル基、3,4,4-トリフルオロ-1,3-ブタジエニル基、3,4-ジブロモ-1-ペンテニル基、 3.3.4.4.5.5.5-ヘプタフルオロ-1-ペンテニル基、5.5-ジフルオロ-4-ペンテニル基、 15 4, 5, 5-トリフルオロ-4-ペンテニル基、3, 4, 4, 4-テトラフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ブテニル基、3, 5, 5-トリフルオロ-2, 4-ペンタジエニル基、4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ヘプタフル オロ-2-ヘキセニル基、3, 4, 4, 5, 5, 5-ヘキサフルオロ-3-トリフルオロメチル-1-ペンテニ ル基、4,5,5,5-テトラフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル基、5-ブロモ-20 4, 5, 5-トリフルオロ-4-トリフルオロメチル-2-ペンテニル基、3, 3, 3-トリフルオロ-1-ペ ンタフルオロエチル-2-トリフルオロメチル-1-プロペニル基、4.5.5.6.6.6-ヘキサフル オロ-4-トリフルオロメチル-2-ヘキセニル基、3-パーフルオロブチル-2-プロペニル基、 3-ヨード-2-オクテニル基、2-パーフルオロヘキシルエテニル基、3-パーフルオロヘキシ ル-2-プロペニル基、12-ブロモ-2-ドデセニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に 1 個又は 2 個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、1-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、2-ペンチニル基、1-

の炭素原子数の範囲で選択される。

25

エチル-2-プロピニル基、1,1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、4-ペンチニル基、1-メチル-3-ブチニル基、2-メチル-3-ブチニル基、1,1-ジメチル-2-プロピニル基、1-ヘキシニル基、3、3-ジメチル-1-ブチニル基、1-(n-プロピ ル)-2-プロピニル基、2-ヘキシニル基、1-エチル-2-ブチニル基、3-ヘキシニル基、1-メ チル-2-ペンチニル基、1-メチル-3-ペンチニル基、5-ヘキシニル基、1-エチル-3-ブチニ 5 ル基、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル基、1-(i-プロピル)-2-プロピニル基、1,1-ジメ チル-2-ブチニル基、2,2-ジメチル-3-ブチニル基、1-ヘプチニル基、1-(n-ブチル)-2-プ ロピニル基、2-ヘプチニル基、3-ヘプチニル基、1-メチル-3-ヘキシニル基、1-エチル-2-ペンチニル基、1-エチル-3-ペンチニル基、6-ヘプチニル基、1-メチル-1-(n-プロピ)ル)-2-プロピニル基、1-(i-プロピル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-(i-ブチル)-2-プロ 10 ピニル基、5-メチル-3-ヘキシニル基、1,1-ジメチル-2-ペンチニル基、1-エチル-1-メチ ル-2-ブチニル基、1-オクチニル基、1-(n-ペンチル)-2-プロピニル基、2-オクチニル基、 3-オクチニル基、1-メチル-3-ヘプチニル基、1-エチル-3-ヘキシニル基、7-オクチニル 基、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-(1-メチルブチル)-2-プロピニル基、1-15 (j-ブチル)-1-メチル-2-プロピニル基、2-ノニニル基、3-ノニニル基、1-エチル-3-ヘプ チニル基、1-メチル-1-(n-ペンチル)-2-プロピニル基、1-(n-ブチル)-1-メチル-2-ブチ ニル基、1-(n-ブチル)-1-エチル-2-プロピニル基、1-(1-エチルプロピル)-1-メチル-2-プロピニル基、1-デシニル基、2-デシニル基、3-デシニル基、5-デシニル基、9-デシニ ル基、1-(n-ヘキシル)-1-メチル-2-プロピニル基、2-ウンデシニル基、10-ウンデシニル 基、5,10-ウンデカジイニル基、3-ドデシニル基、7-ドデシニル基、9-ドデシニル基、 20 10-ドデシニル基、11-ドデシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子 数の範囲で選択される。

本明細書における C_a~C_bハロアルキニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に 1 個又は 2 個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表す。このとき、 2 個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっていても良い。例えば 2-クロロエチニル基、2-ブロモエチニル基、2-ヨードエチニル基、3-クロロ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ブロモ-2-プロピニル基、3-ラロ

25

ロ-1-メチル-2-プロピニル基、3-ブロモ-1-メチル-2-プロピニル基、3-ヨード-1-メチル-2-プロピニル基、3-クロロ-1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ブロモ-1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、3-ブロモ-1, 1-ジメチル-2-プロピニル基、1-クロロメチル-1-メチル-2-ブチニル基、4-クロロ-2, 2-ジメチル-3-ブチニル基、4-ブロモ-2, 2-ジメチル-3-ブチニル基、4-ヨード-2, 2-ジメチル-3-ブチニル基、10-ブロモ-9-デシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルケニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ 1 個又は 2 個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、 3 員環から 6 員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合は endo-又は exo-のどちらの形式であってもよい。例えばシクロペンテン-1-イル基、 2-シクロペンテン-1-イル基、 3-シクロペンテン-1-イル基、 3-シクロペンテン-1-イル基、 3-シクロペンテン-1-イル基、 4-メチレンシクロペンチル基、 2-シクロヘキセン-1-イル基、 2-メチルー2-シクロヘキセン-1-イル基、 1-メチルー2-シクロヘキセン-1-イル基、 4-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 4-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 4-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 4-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-メチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 5-ジメチルー3-シクロヘキセン-1-イル基、 2-メチルビシクロ [2. 2. 1] -5-ヘプテン-2-イル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

15

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルケニルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の、且つ1 個又は2 個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、3 員環から6 員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、さらに、二重結合は endo又は exo-のどちらの形式であってもよい。また、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、2 個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、または互いに相異なっていても良い。例えば 2-クロロビシクロ [2.2.1] -5-ヘプテン-2-イル

基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

15

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-0-基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロピルオキシ基、i-プロピルオキシ基、n-ブチルオキシ基、s-ブチルオキシ基、i-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブリカオキシ基、t-ブリカオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における C_a~C_bハロアルコキシの表記は、炭素原子数が a~b 個よりなる前記 の意味であるハロアルキル-0-基を表し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2, -テトラフルオロエトキシ基、2-クロロー1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2-ブロモー1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2-ブロモー1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2-ブロモー1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ基、2, 2-ジクロロー1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2, 2-テトラフルオロエトキシ基、2, 2-ジクロロー1, 1, 2-トリフルオロエトキシ基、2, 2, 2-トリクロロー1, 1-ジフルオロプロピルオキシ基、2-クロロプロピルオキシ基、3-クロロプロピルオキシ基、ヘプタフルオロプロピルオキシ基、2, 2, 3, 3- テトラフルオロプロピルオキシ基、1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基、2-ブロモ-1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基、2-ブロモ-1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロシクロアルキルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロシクロアルキル-0-基を表し、例えば 2, 2, 4, 4-テトラフルオロシクロブチルオキシ基、 2-クロロ-2, 3, 3-トリフルオロシクロブチルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル-0-基を表し、例えばアリルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、1-メチル-2-プロペニルオキシ基、3-メチル-2-ブテニルオキシ基、1, 1-ジメチル-2-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択され

る。

10

15

20

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-0-基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ基、 3, 3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ基、 2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルオキシ基、 3, 3-トリフルオロ-1-(ペンタフルオロエチル)-2-(トリフルオロメチル)-1-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル-0-基を表し、例えばプロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、1-エチル-2-プロピニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、1-メチル-2-ブチニルオキシ基、1, 1-ジメチル-2-プロピニルオキシ基、2-ヘキシニルオキシ基、1-エチル-2-ブチニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキニル-0-基を表し、例えば 3-クロロ-2-プロピニルオキシ基、 3-ブロモ-2-プロピニルオキシ基、 3-ヨード-2-プロピニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、t-ブチルグチルチオ基、t-ブチルグラルチオ基、t-ブチルグランチルグランチルグロピルチオ基、t-ブナルチオ基、t-ブナルチオ基、t-ブナルチオ基、t-ブナルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブロピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリピルチオ基、t-ブリチオ基、t-ブリピルチオ国に

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-基を表し、例えばジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基、1,1,2-トリフルオロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、2-ブロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基、ヘプタフ

ルオロプロピルチオ基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルチオ基、 ノナフルオロブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲 で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル-S-基を表し、例えばアリルチオ基、2-プテニルチオ基、1-メチル-2-プロペニルチオ基、3-メチル-2-プテニルチオ基、1, 1-ジメチル-2-プロペニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル-S-基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルチオ基、3, 3-ジクロロ-2-プロペニルチオ基、2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルチオ基、3, 4, 4-トリフルオロ-3-プテニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

15

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキニルチオの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル-S-基を表し、例えばプロパルギルチオ基、2-ブチニルチオ基、2-ペンチニルチオ基、1-メチル-2-ブチニルチオ基、1, 1-ジメチル-2-プロピニルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S (0) -基を表し、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、n-プロピルスルフィニル基、i-プロピルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n-ブチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル基、n- ガチルスルフィニル

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S (0) -基を表し、例えばジフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基、2-プロモ-1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル基、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-トリフルオロメチルエチルスルフィニル基、ノナフルオロブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個

よりなる前記の意味であるハロアルケニル-S(0)-基を表し、例えば 3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニルスルフェニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル $-SO_2$ -基を表し、例えばメタンスルホニル基、エタンスルホニル基、n-プロピルスルホニル基、i-プロピルスルホニル基、n-ブチルスルホニル基、s-ブチルスルホニル基、i-ブチルスルホニル基、t-ブチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル $-SO_2$ -基を表し、例えばジフルオロメタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、クロロジフルオロメタンスルホニル基、プロモジフルオロメタンスルホニル基、2,2,2-トリフルオロエタンスルホニル基、1,1,2-テトラフルオロエタンスルホニル基、1,1,2-トリフルオロ-2-クロロエタンスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

15

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルスルホニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニル $-SO_2$ -基を表し、例えば 3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルスルホニル基、 3, 3-ジクロロ-2-プロペニルスルホニル基、 2, 3, 3-トリフルオロ-2-プロペニルスルホニル基、 3, 4, 4-トリフルオロ-3-ブテニルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20 本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、i-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、i-ブチルアミノ

25 本明細書におけるジ(C_a~C_bアルキル)アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも、又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数が a~b 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル(メチル)アミノ基、ジエチルアミノ基、n-プロピル(メチル)アミノ基、i-プロピル(メチル)アミノ基、ジ(n-プロピル)アミノ基、n-プチル(メチル)アミノ基、i-プチル(メチル)

15

アミノ基、t-ブチル (メチル) アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原 子数の範囲で選択される。

本明細書における C_a~C_bアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が a~b 個よりなる 前記の意味であるアルキル-C (0) -基を表し、例えば CH₂C (0) -基、CH₂CH₂C (0) -基、

CH₃CH₂CH₂C (0) -基、 (CH₃) ₂CHC (0) -基、 CH₃ (CH₂) ₃C (0) -基、 (CH₃) ₂CHCH₂C (0) -基、 CH₃CH₂CH (CH₃) C (0) -基、 (CH₃) ₃CC (0) -基、 CH₃ (CH₂) ₄C (0) -基、 CH₃ (CH₂) ₅C (0) -基等が具体例と して挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における C_a~C_bハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が a~b 個より なる前記の意味であるハロアルキル-C(0)-基を表し、例えば FCH₂C(0)-基、C1CH₂C(0)-基、 F₂CHC (0) -基、Cl₂CHC (0) -基、CF₃C (0) -基、ClCF₂C (0) -基、BrCF₂C (0) -基、CCl₃C (0) -基、 CF₃CF₂C (0) -基、C1CH₂CH₂CH₂C (0) -基、CF₃CF₂CF₂C (0) -基、C1CH₂C (CH₃) ₇C (0) -基等が具体例と して挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりな る前記の意味であるアルキル-0-C (0) -基を表し、例えば CH₃OC (0) -基、CH₃CH₂OC (0) -基、 CH₃CH₂CH₂OC (0) -基、 (CH₃) 2CHOC (0) -基、 CH₃ (CH₂) 3OC (0) -基、 (CH₃) 2CHCH₂OC (0) -基、 (CH₂)₃COC (0)-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択され る。

本明細書における C_a~C_bハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が a~b 個よ りなる前記の意味であるハロアルキル-0-C(0)-基を表し、例えば C1CH2CH2OC(0)-基、

CF₃CH₂OC (0)-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。 20 本明細書における C_a~C_bアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素 原子数が a~b 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル 基を表し、例えば CH₃NHC (0) -基、CH₃CH₂NHC (0) -基、CH₃CH₂CH₂NHC (0) -基、 (CH₃) ₂CHNHC (0) -基、CH3 (CH3) 3NHC (O) -基、(CH3) 2CHCH2NHC (O) -基、CH3CH2CH (CH3) NHC (O) -基、(CH3) 3CNHC (O) -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。 25

本明細書におけるジ(C₃~C_bアルキル)アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、 それぞれ同一でも、又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数が a~b 個よりなる前記 の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば (CH₃) 2NC (0) -基、CH₃CH₂N (CH₃) C (0) -基、 (CH₃CH₂) 2NC (0) -基、 (CH₃CH₂CH₂) 2NC (0) -基等が具体例として挙

げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

5

10

15

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルアミノチオカルボニルの表記は、水素原子の一方が 炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたチオカル バモイル基を表し、例えば CH_3NHC (S) -基、 CH_3CH_2NHC (S) -基、 $CH_3CH_2CH_2NHC$ (S) -基、

 $(CH_3)_2$ CHNHC (S) -基、 CH_3 $(CH_2)_3$ NHC (S) -基、 $(CH_3)_2$ CHCH $_2$ NHC (S) -基、 $(CH_3)_3$ CNHC (S) -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるジ ($C_a \sim C_b P N$ キル) アミノチオカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも、又は互いに相異なっていてもよい炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたチオカルバモイル基を表し、例えば (CH_3) $_2NC$ (S) –基、 CH_3CH_2N (CH_3) C (S) –基、(CH_3CH_2) C0 (C) –基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル $-SO_2-0$ -基を表し、例えば CH_3SO_2-0 -基、 $CH_3CH_2SO_2-0$ -基、 $CH_3CH_2SO_2-0$ -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル $-SO_2-0$ -基を表し、例えば CF_3SO_2-0 -基、 $CF_3CF_3SO_2-0$ -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-C (0) -0-基を表し、例えば CH_3C (0) -0-基、 CH_3CH_2C (0) -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ ハロアルキルカルボニルオキシの表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-C(0) -0-基を表し、例えば FCH_2C (0) -0-基、 $C1CH_2C$ (0) -0-基、 F_2CHC (0) -0-基、 $C1_2CHC$ (0) -0-基、 CF_3C (0) -0-基、 $C1CF_2C$ (0) -0-基、 $C1CH_2CH_2C$ (0) -0-基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 55

される。

5

10

20

25

本明細書における R¹によって任意に置換された(C₂~C₂) アルキル、R²¹によって任意に 置換された(C。~C、)アルキル、R30によって任意に置換された(C。~C、)アルキル又はR31に よって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} によって、 炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が a~b 個よりなる直鎖状又 は分岐鎖状の炭化水素基を表し、ここで、それぞれの(C,~C,)アルキル基上の置換基 R⁷、 R²¹、R³⁰又はR³¹が2個以上存在するとき、それぞれのR⁷、R²¹、R³⁰又はR³¹は互いに同一で も、または互いに相異なっていてもよい。

本明細書における $C_a \sim C_b$ シクロアルキル $(C_d \sim C_c)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_d \sim C_c)$ アルキ ル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ ($C_d \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_d \sim C_c$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ $(C_a \sim C_e)$ アルキル、 $(C_a \sim C_b)$ アルキル、 $(C_a \sim C_e)$ アルキル・ $(C_a \sim C_e)$ て置換されていてもよいフェニルチオ(C₄~C₆)アルキル、C₆~C₅アルキルスルフィニル(C₆ ~C_a)アルキル、C_a~C_bハロアルキルスルフィニル(C_a~C_a)アルキル、C_a~C_bアルキルスル ホニル $(C_a \sim C_a)$ アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルスルホニル $(C_a \sim C_a)$ アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキ ルカルボニル ($C_a \sim C_a$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル ($C_a \sim C_a$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ ハ ロアルコキシカルボニル ($C_a \sim C_e$) アルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルアミノカルボニル ($C_a \sim C_e$) アル キル、ジ(C_a~C_bアルキル)アミノカルボニル(C_a~C_c)アルキル、トリメチルシリル(C_a~C_c) アルキル、 $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_4 \sim C_6)$ アルキル、L- $(C_4 \sim C_6)$ ア ルキル又は M-(C_d~C_e)アルキル等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の C₂~C_bシク ロアルキル基、水酸基、C_a~C_bアルコキシ基、C_a~C_bハロアルコキシ基、C_a~C_bアルキル チオ基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキルチオ基、 $(Z)_{Dl}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ 基、C₂~C₅アルキルスルフィニル基、C₂~C₅ハロアルキルスルフィニル基、C₂~C₅アルキ ルスルホニル基、C₂~C₅ハロアルキルスルホニル基、C₂~C₅アルキルカルボニル基、C₂~ C_bアルコキシカルボニル基、C_a~C_bハロアルコキシカルボニル基、C_a~C_bアルキルアミノ カルボニル基、 $\mathcal{O}(C_a \sim C_b r n + n) r > 1$ カルボニル基、トリメチルシリル基、 $(Z)_{n}$ に よって置換されていてもよいフェニル基、L基又はM基によって、炭素原子に結合した水 素原子が任意に置換された炭素原子数が d~e 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素 基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるヒドロキシ $(C_d \sim C_e)$ ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ $(C_d \sim C_e)$ ハロアル

WO 03/011028

10

15

20

25

キル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ ($C_a \sim C_c$) ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルケニルオキシ ($C_d \sim C_c$) ハロ アルキル、C_a~C_bハロアルケニルオキシ (C_a~C_e) ハロアルキル、C_a~C_bアルキニルオキシ $(C_a \sim C_e)$ ハロアルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルキニルオキシ $(C_a \sim C_e)$ ハロアルキル又は $(Z)_{ol}$ に よって置換されていてもよいベンジルオキシ(C₄~C₆)ハロアルキル等の表記は、それぞれ 前記の意味である任意の水酸基、C_a~C_bアルコキシ基、C_a~C_bハロアルコキシ基、C_a~C_b アルケニルオキシ基、C,~C,ハロアルケニルオキシ基、C,~C,アルキニルオキシ基、C,~ C,ハロアルキニルオキシ基又は(Z) u によって置換されていてもよいペンジルオキシ基に よって、炭素原子に結合した水素原子又はハロゲン原子が任意に置換された炭素原子数 が d~e 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基を表し、例えば 1, 2, 2, 2-テトラフル オロ-1-(メトキシ)エチル基、2.2.2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(メチル)エチル基、 2. 2. 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(トリフルオロメチル) エチル基、2. 2. 2-トリフル オロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-エトキシ-2、2、2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2,2,2-トリフルオロ-1-n-プロピルオキシ-1-(トリフ ルオロメチル) エチル基、2. 2. 2-トリフルオロ-1-i-プロピルオキシ-1-(トリフルオロメ チル) エチル基、1-n-ブチルオキシ-2、2、2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル 基、2.2.2-トリフルオロ-1-(2.2.2-トリフルオロエトキシ)-1-(トリフルオロメチル) エ チル基、1-アリルオキシ-2、2、2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1-(3, 3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エ チル基、1-(3,3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ)-2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロ メチル) エチル基、2. 2. 2-トリフルオロ-1-トリフルオロメチル-1-(2. 3. 3-トリフルオロ-2-プロペニルオキシ) エチル基、2, 2, 2-トリフルオロ-1-プロパルギルオキシ-1-(トリフ ルオロメチル) エチル基、1-ベンジルオキシ-2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチ ル) エチル基、2-クロロ-1-ヒドロキシ-2, 2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル 基、2-クロロ-2、2-ジフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-ブロ モ-1-ヒドロキシ-2, 2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、2-ブロモ-2, 2-ジ フルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル) エチル基、1-ヒドロキシ-2-メチル-1-(ト リフルオロメチル) プロピル基、1-ヒドロキシ-2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロ-1-(トリフル オロメチル)プロピル基、2.2.3.3.3-ペンタフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチ ル)プロピル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における \mathbb{R}^{7} によって任意に置換された $(\mathbb{C}_{a} \sim \mathbb{C}_{b})$ シクロアルキル、 \mathbb{R}^{21} によって 任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル、 R^{80} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) シクロ アルキル又は R^{31} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ シクロアルキル等の表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子 数が a~b 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表す。このとき、 \mathbb{R}^7 、 \mathbb{R}^{21} 、 \mathbb{R}^{30} 又は R⁸¹による置換は、環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両 方であってもよく、さらに、それぞれの ($C_a \sim C_b$) シクロアルキル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は \mathbb{R}^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの \mathbb{R}^7 、 \mathbb{R}^{21} 、 \mathbb{R}^{30} 又は \mathbb{R}^{31} は互いに同一でも、ま たは互いに相異なっていてもよい。

10

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルケニル $(C_d \sim C_e)$ シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニル $(C_d \sim C_e)$ \sim C_e) シクロアルキル、ヒドロキシ(C_d \sim C_e) シクロアルキル、C_a \sim C_bアルコキシ(C_d \sim C_e) シ クロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ ($C_d \sim C_e$) シクロアルキル、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニ $\mathcal{V}(C_d \sim C_e)$ シクロアルキル又は $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル $(C_d \sim C_e)$ シクロアルキル等の表 記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルケニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルケニル基、 水酸基、 $C_a \sim C_b$ アルコキシ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ基、 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル基又 は $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換さ れた炭素原子数が d~e 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表し、例えば 2-ビニルシクロプロピル基、3,3-ジメチル-2-(2-メチル-1-プロペニル)シクロプロピル基、 2-(2, 2-ジクロロエテニル)-3, 3-ジメチルシクロプロピル基、2-(2-クロロ-3, 3, 3-トリフ ルオロ-1-プロペニル) -3, 3-ジメチルシクロプロピル基、1-(メチルチオメチル) シクロプ ロピル基、1-(メチルスルフィニルメチル) シクロプロピル基、1-(メチルスルホニルメチ ル)シクロプロピル基、1-(メチルチオメチル)シクロブチル基、2-アリルシクロペンチル 基、1-(ヒドロキシメチル)シクロペンチル基、1-(メチルチオメチル)シクロペンチル基、 1- (メチルスルフィニルメチル) シクロペンチル基、1- (メチルスルホニルメチル) シクロ ペンチル基、2-(メチルチオ)シクロペンチル基、2-(メチルチオ)シクロヘキシル基等が 具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における \mathbb{R}^{7} によって任意に置換された $(\mathbb{C}_{a} \sim \mathbb{C}_{b})$ アルケニル、 \mathbb{R}^{21} によって任意 に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルケニル又は R^{31} によって任意に置換された ($C_a \sim C_b$) アルケニルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} に よって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a\sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル基を表し、ここで、それぞれの $(C_a\sim C_b)$ アルケニル基上の置換基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに同一でも、または互いに相異なっていてもよい。

本明細書における $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_a \sim C_p)$ アルケニル又は $L-(C_a \sim C_p)$ アルケニル等の表記は、任意の $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル基 又は L 基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルケニル基を表し、例えば 1, 1-ジメチル-3-フェニル-2-プロペニル基、 1, 1-ジメチル-3- (チオフェン-2-イル) -2-プロペニル基等が具体例として 挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

5

10

15

20

25

本明細書における R^7 によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル又は R^{31} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニル又は R^{31} によって任意に置換された $(C_a \sim C_b)$ アルキニルの表記は、任意の R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} に よって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる 前記の意味であるアルキニル基を表し、ここでそれぞれの $(C_a \sim C_b)$ アルキニル基上の置換 基 R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} が 2 個以上存在するとき、それぞれの R^7 、 R^{21} 、 R^{30} 又は R^{31} は互いに 同一でも、または互いに相異なっていてもよい。

本明細書における $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_a \sim C_b)$ アルキニル又は $L-(C_a \sim C_b)$ アルキニル等の表記は、任意の $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル基 又は L 基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル基を表し、例えば 1, 1-ジメチル-3-フェニル-2-プロピニル基、 <math>1, 1-ジメチル-3-(チオフェン-2-イル)-2-プロピニル基、 <math>1, 1-ジメチル-3-(ナオフェン-3-イル)-2-プロピニル基、 <math>1, 1-ジメチル-3-(ヒリジン-2-イル)-2-プロピニル基、 <math>1, 1-ジメチル-3-(ヒリジン-2-イル)-2-プロピニル基、 <math>1, 1-ジメチル-3-(ヒリジン-3-イル)-2-プロピニル基等が具体例として挙げられ、 20 名々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル基、 $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシカルボニル基又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよい

フェニル基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が d~ e 個よりなる前記の意味であるアルコキシ基を表し、例えば $\mathrm{CH_3OC}$ (0) $\mathrm{CH_2}$ -0-基、

CH₃CH₂OC (0) CH₂-0-基、CH₃OC (0) CH₂CH₂-0-基、CH₃CH₂OC (0) CH₂CH₂-0-基、CH₃OC (0) CH (CH₃) -0-基、CH₃OC (0) C (CH₃) 2-0-基、CH₃CH₂OC (0) C (CH₃) 2-0-Δ

10

15

20

25

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシ $(C_d \sim C_e)$ ハロアルケニルオキシ又は $C_a \sim C_b$ ハロアルケニルオキシ等の表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシ基又は $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子又は ハロゲン原子が任意に置換された炭素原子数が $d \sim e$ 個よりなる前記の意味であるハロアルケニルオキシ基を表し、例えば 3, 3, 3-トリフルオロ-1-メトキシ-2-(トリフルオロメチル) -1-プロペニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_a \sim C_b$ アルコキシ $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ $(C_f \sim C_g)$ アルキル等の表記は、前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ アルコキシ $(C_d \sim C_e)$ アルコキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された、炭素原子数が $f \sim g$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、例えば $2-(2- \chi + 2 \chi +$

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 60

チル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における C,~C,ハロアルコキシ (C,~C,) ハロアルコキシ (C,~C,) ハロアルコキ シ等の表記は、前記の意味である任意の $C_a \sim C_b$ ハロアルコキシ $(C_a \sim C_c)$ ハロアルコキシ基 によって、炭素原子に結合した水素原子又はハロゲン原子が任意に置換された炭素原子 数が $f \sim g$ 個よりなる前記の意味であるハロアルコキシ基を表し、例えば 1. 1. 2-トリフル オロ-2-(ヘキサフルオロ-2-(ヘプタフルオロプロピルオキシ)プロピルオキシ)エトキシ 基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における(Z)」によって置換されていてもよいフェニル(C,~C,)アルキルカルボ ニルの表記は、(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に結 合した水素原子が任意に置換された前記の意味である (C_a~C_b) アルキルカルボニル基を表 し、例えば $PhCH_2-C$ (0) -基、 $PhCH_2CH_2-C$ (0) -基、PhCH (CH_3) -C (0) -基、PhC (CH_3) $_2-C$ (0) -基等 が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

本明細書における(Z), によって置換されていてもよいフェニル(C,~C,)アルコキシカル ボニルの表記は、(Z)』によって置換されていてもよいフェニル基によって、炭素原子に 結合した水素原子が任意に置換された前記の意味である(C_a~C_b)アルコキシカルボニル基 を表し、例えば PhCH₂-O-C (0) -基、PhCH₂CH₂-O-C (0) -基、PhCH (CH₃) -O-C (0) -基、 PhC (CH₃) $_2$ -0-C (0) -基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択 される。

一般式(1)で表される本発明化合物のうち、好ましい化合物は下記の一般式(4) 20 又は一般式 (5) で表される化合物である。

$$(X^{2}) \xrightarrow{H} Y^{1} \qquad Y^{2}$$

$$(X^{2}) \xrightarrow{H} Y^{1} \qquad X^{2}$$

$$(X^{3})_{n} \qquad X^{3} \qquad X^{3}$$

$$(X^{4}) \qquad X^{5} \qquad X^{6} \qquad X$$

Y²で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

すなわち、Y²-I:水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、C₁~C₀アルキル、C₁~C₀

アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチ オ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィ ニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ ルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル。

 $Y^2-II: C_1 \sim C_6 \cap T$ 5

10

15

20

 Y^2 -III: ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 C_1 $\sim C_6$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6 \land \Box P \lor C_2 \lor A + b \lor (C_1 \sim C_4) \land \Box P \lor A + b \lor (C_1 \sim C_4) \land (C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル又は $(Z)_{11}$ によって置換され ていてもよいベンジルオキシ(C1~C4)ハロアルキル。

 Y^2 -IV: $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $(Z)_{n1}$ によって置換されて いてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M。

キシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ、 $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim$ C_4) ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2\sim C_8$ ハロアルケニルオキシ、 C_1 $\sim C_6$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ ハロアルケ ニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 (Z)」によって置換されていてもよいフェノキシ、-0-(L-17)、-0-(L-45)、-0-(L-48)又 は-0-(L-49)。

 $Y^2-VI:-SF_5,\ C_1\sim C_6\, \text{\it T} \text{\it U}+\text{\it U}+\text{\it T}\text{\it J},\ C_1\sim C_6\, \text{\it N}\text{\it D}\text{\it T}\text{\it U}+\text{\it U}+\text{\it T}\text{\it J},\ C_2\sim C_6\, \text{\it N}\text{\it D}\text{\it T}\text{\it U}+\text{\it U}+\text$ オ、(Z) n によって置換されていてもよいフェニルチオ、-S-(L-17)、-S-(L-45)、-S-(L-48)、-S-(L-49)、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2\sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_8$ ハロアルケニルスルホニル、-N (\mathbb{R}^9) \mathbb{R}^{8b} 又は

25 -Si (CH₃) ${}_{2}R^{14}$.

Y²-VII:Y²が隣接するY³と-CH,CH,O-, -CH2OCH2-, -OCH2O-, -CH2CH2S-, -CH2SCH2-, $-\mathrm{CH_2CH_2CH_2O-}, \quad -\mathrm{CH_2CH_2OCH_2-}, \quad -\mathrm{CH_2OCH_2O-}, \quad -\mathrm{OCH_2CH_2O-}, \quad -\mathrm{OCH_2CH_2S-}, \quad -\mathrm{OCH=N-}, \quad -\mathrm{SCH=N-} \\ \times \mathrm{CH_2CH_2CH_2O-}, \quad -\mathrm{OCH_2CH_2O-}, \quad -\mathrm{OCH_2CH_2$ は-N (R^{17}) CH=N-を形成することにより、 Y^2 及び Y^3 が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6員環を形成し、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R¹⁸によって任意に置 換されていてもよい。

10

15

R³で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

すなわち、 R^3 -I: $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_8$) アルキル、(Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル($C_1 \sim C_8$) アルキル、L-($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、(Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_8$) アルキニル又は L-($C_1 \sim C_8$) アルキニル。

 R^3 -II: H0- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 R^{8c} -0- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-1)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-2)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-3)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-4)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-5)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-6)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-7)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-14)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-15)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-16)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-23)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-24)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-25)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-15)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-25)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-16)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-16)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-16)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-25)- $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-16)- $(C_1 \sim C_8)$ - $(C_1$

 R^{3} -III: $HS-(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、 R^{29} - $S-(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、 R^{29} -S(0) - $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、 R^{29} -S(0) $_{2}$ - $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-8)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-9)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-10)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-11)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-17)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-18)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-19)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-26)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-27)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル、(M-28)- $(C_{1}\sim C_{8})$ アルキル

 R^3 -IV: R^8 cN (R^9) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-12) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-13) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-20) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-21) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-22) - $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、(M-21) スは M-22。

20 $R^3-V: HC (0) - (C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(Z)_{p_1}$ に よって置換されていてもよいフェニルカルボニル $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_8)$ シアノアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキル。

 R^3 –VI: C_3 ~ C_8 シクロアルキル、 C_1 ~ C_4 アルキルチオ (C_3 ~ C_8) シクロアルキル、 C_1 ~ C_4 アルキルスルフィニル (C_3 ~ C_8) シクロアルキル又は C_1 ~ C_4 アルキルスルホニル (C_3 ~ C_8) シクロアルキル。

 \mathbb{R}^3 -VII: $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又はジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ。

 R^3 -VIII: R^3 が R^2 と一緒になって $C_2 \sim C_8$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する 窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子

20

及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、メチル基又はメトキシ基によって置換されていてもよい。

R⁵で表される置換基に関して、好ましい範囲は下記の各群である。

すなわち、 \mathbb{R}^5 - \mathbb{I} : $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ シクロアルキル($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル又は $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキニル。

 R^{5} -II: $C_{1}\sim C_{4}$ アルコキシ ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 $C_{1}\sim C_{4}$ アルキルチオ ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 $C_{2}\sim C_{6}$ シアノアルキル、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルコキシカルボニル ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルキル 、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルキルアミノカルボニル ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 ジ ($C_{1}\sim C_{6}$ アルキル) アミノカルボニル ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルキル) アミノカルボニル ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルキル、 ($C_{1}\sim C_{4}$) アルキル。

 R^{5} —III: -OH、 $C_{1}\sim C_{6}$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、-S (0) ${}_{2}R^{24}$ 、-SN (R^{26}) R^{25} 又は -S (0) ${}_{2}N$ (R^{28}) R^{27} 。

15 $R^{5}-IV: -CHO, -C(0)R^{10}, -C(0)OR^{10}, -C(0)SR^{10}, -C(0)N(R^{11})R^{10}, -C(0)C(0)OR^{10}, -C(S)OR^{10}, -C(S)SR^{10}$ \nearrow $L^{2}-C(S)N(R^{11})R^{10}$.

 $R^5-V:R^5$ が R^6 と一緒になって $C_2\sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3\sim 7$ 員環を形成し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよい。

これらの一般式(1)で表される化合物に関して、好ましい化合物の範囲を示す一般式(4)及び一般式(5)と各置換基の好ましい範囲を示す各群とは、それぞれ任意に組み合わせることができ、それぞれ好ましい本発明化合物の範囲を表すが、以下に特に好ましい範囲の組み合わせを挙げる。

25 すなわち、一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-I、R³-Iと R⁵-I である本発明化合物。

一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -I、 R^3 -I と R^5 -IV である本発明化合物。

一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合

物。

- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-I と R⁵-II である本発明化合物。
- 一般式(4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-I と R⁵-III である本発明化 5 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 \mathbb{R}^3 -I と \mathbb{R}^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式(4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-I と R⁵-V である本発明化合物。
- 10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-II と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-II と R⁵-IV である本発明化 15 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。
- 20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-III と R⁵-III である本発明 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-IV と R⁵-I である本発明化 25 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -IV と R^5 -II である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -IV と R^5 -IV である本発明化合物。

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -V と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-V と R⁵-II である本発明化合物。
- 5 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-V と R⁵-IV である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-VI と R⁵-II である本発明化 10 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 \mathbb{R}^3 -VI と \mathbb{R}^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-VII と R⁵-I である本発明化合物。
- 15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-VII と R⁵-II である本発明 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -VII と R^5 -IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-VIII と R⁵-I である本発明 20 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -VIII と R^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。
- 25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-Iと R⁵-II である本発明化合物。
 - 一般式(4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-I と R⁵-III である本発明化合物。
 - 一般式(4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-Iと R⁵-IV である本発明化

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 66

合物。

- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -I と R^5 -V である本発明化 合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-II と R⁵-I である本発明化 5 合物。·
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-IIと R⁵-II である本発明 化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-II と R⁵-IV である本発明 化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-III と R⁵-I である本発明 10 化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-III と R⁵-II である本発明 化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 \mathbb{R}^3 -III と \mathbb{R}^5 -IV である本発明 化合物。 15
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-IV と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -IVと R^5 -IIである本発明 化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-IV と R⁵-IV である本発明 20 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-Vと R⁵-I である本発明化 合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-V と R⁵-II である本発明化 25 合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-V と R⁵-IV である本発明化 合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-VI と R⁵-I である本発明化 合物。

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VI と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 \mathbb{R}^3 -VI と \mathbb{R}^5 -IV である本発明 化合物。
- 5 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-VII と R⁵-I である本発明 化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VII と R^5 -IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-VIII と R⁵-I である本発明 10 化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 \mathbb{R}^3 -VIII と \mathbb{R}^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-I と R⁵-I である本発明化合物。
- 15 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-Iと R⁵-II である本発明化 合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-IV 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-II と R⁵-I である本発明化 20 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -II と R^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。
- 25 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-III と R⁵-II である本発明 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -III と R^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-IV と R⁵-I である本発明化

WO 03/011028

合物。

- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IV と R^5 -IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -V と R^5 -I である本発明化合 物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -V と R^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-IV 、 \mathbb{R}^3-VI と \mathbb{R}^5-I である本発明化合物。
- 10 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-VI と R⁵-IV である本発明化 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VII と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-VII と R⁵-IV である本発明 15 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIII と R^5 -I である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VIII と R^5 -IV である本発明化合物。
- 20 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-Iと R⁵-I である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-I と R^5-II である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-Iと R⁵-III である本発明化 25 合物。
 - 一般式(4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-I と R⁵-IV である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-I と R⁵-V である本発明化合物。

- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-I である本発明化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-II と R^5-II である本発明化合物。
- 5 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-II と R⁵-IV である本発明化 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-III と R⁵-II である本発明化 10 合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-III と R⁵-III である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-IV である本発明化合物。
- 15 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-IV と R⁵-I である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-IV と R^5-II である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-IV と R⁵-IV である本発明化 20 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-V と R⁵-II である本発明化合物。
- 25 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-V と R⁵-IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲がY2-V、R3-VIとR5-IIである本発明化

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

合物。

- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-VII と R⁵-I である本発明化 5 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VII と R^5-II である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VII と R^5-IV である本発明化合物。
- 10 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-VIII と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VIII と R^5-IV である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VI、R³-I と R⁵-I である本発明化合 15 物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-I と R^5-IV である本発明化合物。
 - 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 –VI、 R^3 –III と R^5 –I である本発明化合物。
- 20 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VI、R³-III と R⁵-IV である本発明 化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式 (4) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VII、R³-Iと R⁵-II である本発明化 25 合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -I と R^5 -IV である本発明化合物。
 - 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -I である本発明化合物。

- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式(4)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^3 -III と R^5 -IV である本発明化合物。
- 5 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-I、R³-Iと R⁵-I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化 10 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-I と R⁵-III である本発明化 合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -I と R^5 -IV である本発明化合物。
- 15 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-II と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-III と R⁵-I である本発明化 20 合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化合物。
- 25 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-IV と R⁵-II である本発明化 合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-II 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-II、R³-V と R⁵-II である本発明化

合物。

- 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。
- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -II、 \mathbb{R}^3 -VI と \mathbb{R}^5 -II である本発明化 6物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 \mathbb{R}^3 -I と \mathbb{R}^5 -I である本発明化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。
- 10 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-II と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-II と R⁵-II である本発明 化合物。
- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-III と R⁵-I である本発明 15 化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化 合物。
- 20 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-IV と R⁵-II である本発明 化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 \mathbb{R}^3 -V と \mathbb{R}^5 -I である本発明化 合物。
- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-III、R³-V と R⁵-II である本発明化 25 合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -III、 R^3 -VI と R^5 -II である本発明化合物。

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-I と R⁵-I である本発明化合物。
- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -I と R^5 -II である本発明化合物。
- 5 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-II と R⁵-I である本発明化 合物。
 - 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -II と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-III と R⁵-I である本発明化 10 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -III と R^5 -II である本発明化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -IV と R^5 -I である本発明化合物。
- 15 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-IV と R⁵-II である本発明化 合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲が Y^2-IV 、 R^3-V と R^5-I である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-IV、R³-V と R⁵-II である本発明化 20 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VI と R^5 -I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -IV、 R^3 -VI と R^5 -II である本発明化合物。
- 25 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-I と R⁵-I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-I と R⁵-II である本発明化合物。
 - 一般式(5)において、好ましい置換基の範囲がY2-V、R3-IとR5-IIIである本発明化

合物。

- 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-II と R⁵-I である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-II と R⁵-II である本発明化 5 合物。
 - 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。
 - 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。
- 10 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-IV と R⁵-I である本発明化合物。
 - 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、 R^3 -IV と R^5 -II である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-V と R⁵-I である本発明化合 15 物。
 - 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-V と R⁵-II である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-V 、 R^3-VI と R^5-I である本発明化合物。
- 20 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-V、R³-VI と R⁵-II である本発明化 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VI、R³-Iと R⁵-I である本発明化合物。
- 一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VI、R³-Iと R⁵-II である本発明化 25 合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-I である本発明化合物。
 - 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VI 、 R^3-III と R^5-II である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2-VII 、 R^3-I と R^5-I である本発明化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VII、R³-Iと R⁵-II である本発明化合物。

5 一般式(5) において、好ましい置換基の範囲が Y²-VII、R³-III と R⁵-I である本発明 化合物。

一般式 (5) において、好ましい置換基の範囲が Y^2 -VII、 R^8 -III と R^5 -II である本発明化合物。

本発明化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

10 製造法 A

15

20

一般式(6) [式中、A, G, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R¹, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(7) [式中、R⁵ は前記と同じ意味を表し、J¹ は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニルオキシ基(例えば、ピバロイルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホネート基(例えば、メタンスルホニルオキシ基)、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホネート基(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)、アリールスルホネート基(例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基、P-トルエンスルホニルオキシ基)又はアゾリル基(例えば、イミダゾール-1-イル基)のような良好な脱離基を表す。]で表される化合物とを、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(1)において X^1 が NHR^5 である一般式(1-1) [式中、A, G, Y^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^5 , m及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(6)で表される化合物1当量に対して1~50当量の一般式(7)で表されるの化合物を用いることができる。

10

15

20

25

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルー2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチルー2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムへキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、ターシャリーブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(6)で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(6)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(7)で表されるの化合物を用い、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリルやジメチルホルムアミド等の極性溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムターシャリープトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチル

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4

一般式 (1) において X^1 が $-NHR^5$ である一般式 (1-1) [式中、A, G, W¹, X^2 , Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵, m及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物と、一般式 (8) [式中、 R^6 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が-N (R^6) R^5 である本発明 化合物 (1-2) [式中、A, G, W¹, X^2 , Y¹, Y², Y³, R^1 , R^5 , R^6 , m及び n は前記と同じ意味を表す。]を得ることができる。

10 製造法 C

製造法 B

一般式 (1) において G が G-1 且つ R^2 が水素原子であり、 X^1 が-NHR 5 である一般式 (1-3) [式中、A, W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式 (9) [式中、 R^{6a} 及び R^{6b} は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して

不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)において0が0である一般式(3-1) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~100当量の 一般式(9)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、

10 四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N. N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリ

ジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸等の鉱酸類、ギ酸、20 酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸類、トリエチルアミン塩酸塩、ピリジン塩酸塩等のアミン類の酸付加塩、塩化亜鉛、ヨウ化亜鉛、四塩化チタン、塩化セリウム、イッテルビウムトリフレート、三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸を、一般式(1-3)で表される化合物に対して 0.001~1当量用いることができる。

25 反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~10当量の 一般式(9)で表される化合物を用い、ベンゼン、トルエン、メタノール、エタノール、 WO 03/011028 PCT/JP02/07833

ギ酸又は酢酸等の溶媒を用いるか、溶媒量の一般式 (9) で表される化合物を用い、濃塩酸又はp-トルエンスルホン酸等の触媒を一般式 (1-3) で表される化合物 1 当量に対して $0.01\sim0.1$ 当量用いて、 $50\sim180$ での温度範囲で、30分から 24 時間反応を行なうのが好ましい。

5 製造法 D

10

一般式(1)において G が G-1 且つ R^2 が水素原子であり、 X^1 が-NHR 5 である一般式(1-3) [式中、A, W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物と、一般式(10) [式中、 R^{6a} 及び R^{6b} は前記と同じ意味を表し、 J^2 及び J^3 は互いに同一でも又は互いに相異なってもよく、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基(例えば、メトキシ基、エトキシ基)等を表す。] で表される化合物とを、必要ならば塩基又は触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)においてO がO である一般式(3-1) [式中、A, W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

15 反応基質の量は、一般式(1-3)で表される化合物1当量に対して1~50当量の一般式(10)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法 C に記載したものと同様の溶媒を 用いることができる。

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては製造法 A に記載したものと同様の塩基を20 用いることができる。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法 C に記載したものと同様の触媒を用い

ることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

製造法 E

5

10

15

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4

一般式(1)においてGがG-1且つ R^2 が水素原子であり、 X^1 が

-N(R⁵) C(0) C(R^{6a}) (R^{6b}) J⁴ である一般式(1-4) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, m及びnは前記と同じ意味を表し、J⁴がハロゲン原子を表す。] で表される本発明化合物を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(3)においてoが1である一般式(3-2) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R¹, R³, R⁵, R^{6a}, R^{6b}, m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

20 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法 A に記載したものと同様の溶媒を

用いることができる。

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては製造法 A に記載したものと同様の塩基を用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-4)で表される化合物1当量に対して、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムターシャリーブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンやピリジン等を1~3当量用い、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン又は1,4-ジオキサン等の溶媒を用い室温~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法F

5

10

一般式 (1) において X¹ が X¹-2 である一般式 (1-5) [式中、A, G, W¹, X², Y¹, Y², Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵¹, R⁵¹, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、水素化ホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム等の水素化剤と反応させることにより、一般式 (1) において X¹ が−NHCH₂R⁵² である一般式 (1-6) [式中、A, G, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵³, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発の化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(1-5)で表される化合物1当量に対して1~100当量の

水素化剤を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸等の鉱酸類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸、塩化亜鉛、四塩化チタン、塩化セリウム、イッテルビウムトリフレート、三フッ化ホウ素-エーテル錯体等のルイス酸を、一般式(1-5)で表される化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-5)で表される化合物1当量に対して1~10当量のシアノ水素化ホウ素ナトリウムを用い、酢酸中、0~90℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 G

10

15

一般式(6) [式中、A, G, \mathbb{W}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{n} 及び \mathbb{n} は前記と同じ意味を表 20 す。] で表される化合物と、一般式(11) [式中、 \mathbb{R}^{5a} 及び \mathbb{R}^{5b} は前記と同じ意味を表 す。] で表される化合物とを、必要ならば触媒の存在下、必要ならば該反応に対して不

活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(1)において X^1 が X^1 -2 である一般式(1-5) [式中、A, G, W¹, X^2 , Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵a, R⁵b, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式 (6) で表される化合物 1 当量に対して 1 ~ 1 0 0 当量の一 5 般式 (1 1) で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、

四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニト

リル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法 C に記載したものと同様の触媒を用い 20 ることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式 (6) で表される化合物 1 当量に対して $1 \sim 1$ 0 当量の一般式 (1 1) で表される化合物を用い、無溶媒か、又はベンゼン、トルエン等の溶媒を用い、p-トルエンスルホン酸等の触媒を一般式 (6) で表される化合物 1 当量に対して $0.01 \sim 0.1$ 当量用いて、 $50 \sim 150$ の温度範囲で、30 分から 24 時間反応を行なうのが好ましい。

製造法H

25

20

一般式 (12) [式中、G, X^2 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される 化合物と、一般式(13) [式中、A, Y¹, Y², Y³, R¹及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば塩 基の存在下、縮合剤を用いて反応させることにより、一般式(1)において X¹が X¹-1 で あり、W¹が酸素原子である一般式(1-7) [式中、A, G, X², Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(12)で表される化合物1当量に対して1~100当量の 一般式(13)で表される化合物を用いることができる。

縮合剤は、通常のアミド合成に使用されるものであれば特に制限はないが、例えば向 10 山試薬(2-クロロ-N-メチルピリジニウム アイオダイド)、DCC(1.3-ジシクロヘキシル カルボジイミド)、WSC (1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド 塩 酸塩)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、ジメチルプロピニルスルホニウム ブロマ イド、プロパルギルトリフェニルホスホニウム ブロマイド、DEPC(シアノ燐酸ジエチ ル) 等を、一般式(12) で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。 容媒を用いる場合、用いられる容媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何 でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘ プタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、 ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、 四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テ トラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメト

キシエタン、テトラヒドロフラン、1.4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロ

ピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルー2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、アセトニトリル及びジメチルスルホキシド等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

塩基の添加は必ずしも必要ではないが、塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(12)で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(12)で表される化合物1当量に対して1~20当量の一般式(13)で表される化合物及び1~4当量のWSC(1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩)、CDI(カルボニルジイミダゾール)等の縮合剤を用い、必要ならば1~4当量の炭酸カリウム、トリエチルアミン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン等の塩基存在下にて、無溶媒か、又はジクロロメタン、クロロホルム、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、0℃からこれらの溶媒の還流温度の範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 I

10

$$(X^{2})_{m}$$

一般式(14) [式中、 X^1 , X^2 , R^3 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えばケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990年、90巻、879頁等に記載の方法に準じて、位置選択的メタル化後、一般式(15) [式中、A, W^1 , Y^1 , Y^2 , Y^3 及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と反応させることにより、一般式(1)においてGがG-1且つ R^2 が水素原子であり、 W^2 が酸素原子であり、 R^1 が水素原子である一般式(1-8) [式中、A, W^1 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^3 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。製造法 J

一般式(16) [式中、A, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R¹, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(17) [式中、R²及び R³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 H と同様な条件下反応させることにより、一般式(1)において X¹が X¹-1 であり、G が G-1 であり、W²が酸素原子である一般式(1-9) [式中、A, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R¹, R², R³, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法K

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{V^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{C} O$$

$$\frac{\text{Li-reagent}}{W^{2} = C = N - R^{3}}$$

$$(18)$$

$$(18)$$

$$Y^{1} \qquad Y^{2} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{3} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{3} \qquad Y^{4} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{4} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3} \qquad Y^{4} \qquad Y^{2} \qquad Y^{4} \qquad Y^{4} \qquad Y^{2} \qquad Y^{4} \qquad Y^{4} \qquad Y^{2} \qquad Y^{4} \qquad Y^{4$$

一般式(18)[式中、A, X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(19)[式中、 \mathbb{N}^2 及び \mathbb{R}^3 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 I と同様な条件下反応させることにより、一般式(1)においてG が G-1 且つ \mathbb{R}^2 が水素原子であり、 \mathbb{N}^1 が酸素原子であり、 \mathbb{R}^1 が水素原子である一般式(1-10)[式中、A, \mathbb{N}^2 , X^1 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , \mathbb{R}^3 , m及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法L

10

$$(X^{2})_{m}$$
 R^{1}
 $(Y^{1}$
 $(Y^{3})_{n}$
 $(X^{2})_{m}$
 $(X^{2})_{m}$

一般式(1-11) [式中、 \mathbb{W}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^4 , \mathbb{R}^5 , \mathbb{R}^6 , \mathbb{R} , \mathbb{R} 0 及び \mathbb{R} 1 は前記と同じ意味を表し、 \mathbb{R}^5 1 はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$ アルキルスルホネート基(例えば、メタンスルホニルオキシ基)、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$ ハロアルキルスルホネート基(例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基)又はアリールスルホネート基(例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基、 \mathbb{P} 1 トルエンスルホニルオキシ基)のような良好な脱離基を表す。〕で表される本発明化合物を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該

反応に対して不活性な溶媒を用いて環化させることにより、一般式(1)において X^1 が X^1-1 であり、G が G-2 であり、 W^2 が酸素原子である一般式(1-1 2) [式中、 W^1 、 X^2 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、m、n 及び p は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

5 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン及び1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合し

塩基を用いる場合、用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムターシャリーブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(1-7)で表される化合物に対して1~4当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することがで 25 き、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100 時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-11)で表される化合物を溶媒量のピリジン中、0~90 $^{\circ}$ の温度範囲で、10 $^{\circ}$ 分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 M

15

20

て用いてもよい。

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$X^{2} \xrightarrow{HN} C$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$X^{1} \xrightarrow{HN} C$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$X^{1} \xrightarrow{HN} C$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{R^{1}} (Y^{3})_{n}$$

$$(1-10)$$

一般式(1-13)[式中、 \mathbb{W}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^4 , \mathbb{R}^6

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては製造法 L に記載したものと同じものを用いることができる。

反応温度は0℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、 10 反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間 の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(1-13)で表される化合物1当量に対して1~5当量の 五硫化二リンを用い、トルエン等の溶媒中、室温~90℃の温度範囲で、10分から2 4時間反応を行なうのが好ましい。

15 製造法 N

5

一般式(20) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(17) [式中、R²及びR³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを該反応に対して不活性な溶媒中、又は無溶媒にて、必要ならば触媒の存在下、反応させることにより、一般式(1)において R^1 が水素原子であり、 X^1 が X^1 -1であり、GがG-1である、一般式(1-15) [式中、A, W¹, W², X^2 , Y¹, Y², Y³, R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

5

10

15

20

反応基質の量は、一般式(20)で表される化合物 1 当量に対して $1\sim5$ 0 当量の一般式(17)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば何でもよく、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルー2-ピロリドン等のアミド類、ギ酸、酢酸、プロピオン酸等のカルボン酸類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチルー2-イミダゾリジノ

ン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上 を混合して用いてもよい。

触媒を用いる場合、反応の触媒としては製造法 C に記載したものと同じものを、一般式 (20) で表される化合物に対して0.001~1当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(20)で表される化合物 1 当量に対して $1\sim 10$ 当量の一般式(17)で表される化合物を用い、無溶媒か、又はテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等の溶媒を用い、50 ℃から反応混合物の還流温度の温度範囲で、30 分から24 時間反応を行なうのが好ましい。

製造法 0

5

10

15

$$X^{2}$$
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4

一般式(2 1) [式中、A, W¹, X², Y¹, Y³, Y³, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(1 7) [式中、R²及び R³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 N と同様な条件下反応させることにより、一般式(1)において X¹が X¹-1 であり、Gが G-1 であり、W²が酸素原子であり、R¹が水素原子である一般式(1-1 6) [式中、A, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R², R³, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

製造法 Q

10

一般式 $(2\ 2)$ [式中、 W^2 , X^2 , R^3 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 $(1\ 3)$ [式中、A, Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 N と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において X^1 が X^1-1 であり、G が G-1 であり、 W^2 が酸素原子であり、 R^2 が水素原子である一般式 $(1-1\ 7)$ [式中、A, W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^6 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

一般式 (1) において \mathbb{W}^1 が酸素原子であり、 \mathbb{R}^1 が水素原子である一般式 (1-18) [式中、 \mathbb{A} , \mathbb{G} , \mathbb{X}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{M} 及び \mathbb{N} は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物と、一般式 (23) [式中、 \mathbb{R}^1 及び \mathbb{J}^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 \mathbb{A} と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において \mathbb{W}^1 が酸素原子である一般式 (1-19) [式中、 \mathbb{A} , \mathbb{G} , \mathbb{X}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{M} 及び \mathbb{N} は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。製造法 \mathbb{R}

10

$$X^{1}$$
 X^{1}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{1}
 X^{2}
 X^{2

一般式 (1) において \mathbb{V}^2 が酸素原子であり、 \mathbb{R}^3 が水素原子である一般式 (1-20) [式中、A, \mathbb{V}^1 , \mathbb{X}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^2 , \mathbb{R}^2 か及び \mathbb{R}^3 は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物と、一般式 (24) [式中、 \mathbb{R}^3 及び \mathbb{J}^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 \mathbb{A} と同様な条件下反応させることにより、一般式 (1) において \mathbb{V}^2 が酸素原子である一般式 (1-21) [式中、 \mathbb{A} , \mathbb{V}^1 , \mathbb{X}^1 , \mathbb{X}^2 , \mathbb{Y}^1 , \mathbb{Y}^2 , \mathbb{Y}^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^2 , \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^3 0 は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。製造法 \mathbb{S}

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{3}
 X^{4}
 X^{2}
 X^{2}
 X^{4}
 X^{4

一般式 (3) において R^5 が水素原子であり、0 が 0 である一般式 (3-3) [式中、A, W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物と、一般式 (7) [式中、 R^5 及び J^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式 (3) において 0 が 0 である一般式 (3-4) [式中、A, W^1 , W^2 , X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 , R^3 , R^5 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

製法A~製法Sにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮、又は有機溶媒に溶解

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 94

し、水洗後濃縮、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行ない、 目的の本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、 カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製 方法によって分離、精製することができる。

5 製造法A及び製造法Gにおいて本発明化合物を製造するための原料化合物である、一 般式(6)で表される化合物の或るものはヨーロッパ特許出願公報(EP 0,919,542号公 報)、国際特許出願公報(WO 01/00599 号公報、WO 01/02354 号公報)等に記載の公知化 合物であり、また、それ以外のものも、これらの合成方法及び文献記載のアニリン誘導 体の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

10 製造法 A 及び製造法 S における一般式 (7) で表される化合物、製造法 B における一 般式(8)で表される化合物、製造法Qにおける一般式(23)で表される化合物及び 製造法 R における一般式(24)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一 部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の一般的な合成方法、 例えばケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 1976年、373頁、テトラヘドロ ン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1972年、4339頁、ザ・ジャーナル・オブ・ 15 オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1976年、41巻、4028頁及び1 978年、43巻、3244頁、オーガニック・シンセシス[Org. Synth.] 1988年、 コレクティブボリューム6巻、101頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカ ル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1964年、86巻、4383頁、英国特許 20 (GB 2, 161, 802 号公報)、ヨーロッパ特許 (EP 0, 051, 273 号公報) 等に記載の方法に準 じて容易に合成することができる。

製造法 C における一般式(9)で表される化合物及び製造法 D における一般式(1 0)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。 また、それ以外のものも文献記載のアルデヒド類、ケトン類、アセタール類及びケター ル類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

製造法Gにおける一般式(11)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、 一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のカルボン酸オルソ エステル類の一般的な合成方法、例えば、ケミストリー・レターズ [Chem. Lett.] 19 76年、891頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J.

Am. Chem. Soc.] 1942年、64巻、1825頁及び1955年、77巻、4571頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1980年、45巻、740頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

製造法 H において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(1 2)で表される化合物は、例えば下記の反応式 1 ~反応式 3 で表される方法等を用いて 合成することができる。

反応式1

5

10

一般式(25) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(17) [式中、 R^2 及び R^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法Nと同様な条件下反応させることにより、一般式(12)においてGがG-1であり、 W^2 が酸素原子である一般式(12-1) [式中、 X^2 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

反応式2

$$(X^{2})_{m}$$

$$H$$

$$CO_{2}$$

$$R^{5} \stackrel{N}{\sim} R^{6} \stackrel{O}{O}$$

$$(14-1)$$

$$Li-reagent$$

$$CO_{2}$$

$$R^{5} \stackrel{N}{\sim} R^{6} \stackrel{O}{\sim} R^{3}$$

$$(14-2)$$

一般式 (14) において X¹が X¹-1 である一般式 (14-1) [式中、X², R³, R⁵, R⁶及 び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えば、ケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990年、90巻、879頁等に記載の方法に準じて、位置選択的メタル化後、炭酸ガスと反応させることにより、一般式 (12) にお

20

いて G が G-1 且つ R^2 が水素原子であり、 W^2 が酸素原子である一般式(1 2-2) [式中、 X^2 , R^3 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。 反応式 3

$$(X^{2})_{m} J^{6} (X^{2})_{m} O (Y^{2})_{m} (Y^{2})_{m}$$

一般式 (26) [式中、X², R³, R⁵, R⁵a, R⁵o及びmは前記と同じ意味を表し、J⁵は臭素 原子、ヨウ素原子、フルオロスルホニルオキシ基又はトリフルオロメタンスルホニルオキシ基を表す。] で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1991年、56巻、4320頁及び1994年、59巻、1216頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1992年、33巻、1959頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式 (27) [式中、X², R³, R⁵, R⁶a, R⁶b及びmは前記と同じ意味を表し、Rはメチル基又はエチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物をうることができる。この一般式 (27) で表されるカルボン酸エステル誘導体は、一般的な加水分解反応条件下、容易に一般式 (12-3) [式中、X², R³, R⁵, R⁶a, R⁶b及びmは前記と同じ意味を表す。] で表されるカルボン酸に変換することができる。

製造法 H 及び製造法 P における一般式 (13)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のアニリン類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1985年、24巻、871頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1964年、29巻、1頁及び1965年、30巻、1001頁、シンセシス [Synthesis] 1984年、667頁、日本化学会誌1973年、2351頁、ドイツ国特許(DE 2606982号公報)、日本国特許(特開平 1-90163号公報)等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

製造法 I における一般式 (14) で表される化合物の或るものは国際特許出願公報 (W0 98/23581 号公報、W0 01/70671 号公報) 等に記載の公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものもこれらの合成方法及び文献記載の公知の方法、例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1994年、35巻、2113頁に記載の方法等に準じて容易に合成することができる。

製造法 I における一般式 (15) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のイソシアネート類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1987年、26巻、894頁及び1995年、34巻、2497頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1976年、41巻、2070頁、シンセシス[Synthesis] 1988年、990頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1997年、38巻、919頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

15 製造法 J において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(1 6)で表される化合物は、例えば下記の反応式 4 又は反応式 5 で表される方法等を用い て合成できる。

反応式4

5

10

一般式 (25) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合 20 物と、一般式 (13) [式中、A, Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^1 及びnは前記と同じ意味を表す。] で表

される化合物とを、製造法 N と同様な条件下反応させることにより、一般式(16)に おいて \mathbb{W}^1 が酸素原子である一般式(16-1) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^5 , \mathbb{R}^6 , \mathbb{R}^6 D 及び \mathbb{R}^6 D で表される化合物を得ることができる。

$$\begin{array}{c}
Y^{1} \\
X^{2} \\
X^{2} \\
X^{2} \\
X^{3} \\
X^{4} \\
Y^{1} \\
X^{2} \\
Y^{1} \\
X^{2} \\
Y^{3} \\
Y^{4} \\
Y^{3} \\
Y^{3} \\
Y^{4} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6} \\$$

一般式 (18) において X^1 が X^1 -1 である一般式 (18-1) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^6 , m及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を、文献記載の公知の方法、例えば、ケミカル・レビューズ [Chem. Rev.] 1990年、90巻、879頁等に記載の方法に準じて、位置選択的メタル化後、炭酸ガスと反応させることにより、一般式 (16) において X^1 が X^1 -1 であり、 W^1 が酸素原子である一般式 (16-2) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^6 , m及び n は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。

製造法 J、製造法 N 及び製造法 0 における一般式 (17) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも、例えばケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン [Chem Pharm Bull.] 1982年、30巻、1921頁、ジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー [J. Am. Chem. Soc.] 1986年、108巻、3811頁、国際特許出願公報(WO 01/23350号公報)等に記載の方法及び文献記載のその他1級又は2級アルキルアミン類それぞれの一般的な合成方法に準じて合成することができる。

製造法 K において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(1 20 8)で表される化合物は、例えば下記の反応式 6 又は反応式 7 で表される方法等を用い て合成できる。

反応式6

5

10

15

すなわち、一般式 (28) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、製造法 A、製造法 B、製造法 F 及び製造法 G と同様な条件下反応させることにより、一般式 (18-1)、 (18-2)、 (18-3)、 (18-4)

及び(18-5) [各式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^{5a} , R^{5b} , R^6 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

一般式 (29) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式 (13) において R^1 が水素原子である一般式 (13-1) [式中、A, Y^1 , Y^2 , Y^3 及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 H と同様な条件下反応させることにより、一般式 (18) において X^1 が X^1-1 である一般式 (18-1) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , R^5 , R^6 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

製造法 K における一般式 (19) で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のイソシアネート類の一般的な合成方法、例えばアンゲバンテ・ヘミー・インターナショナル・エディション・イン・イングリッシュ [Angew. Chem. Int. Ed. Engl.] 1995年、34巻、22頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1970年、35巻、51頁及び1996年、61巻、3883頁、シンセシス [Synthesis] 1987年、907頁及び1988年、990頁、テトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1993年、34巻、3559頁及び1998年、39巻、3749頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

製造法Nにおいて、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(2 20 0)で表される化合物は、例えば下記の反応式8又は反応式9で表される方法等を用い て合成することができる。

反応式8

反応式7

5

10

15

$$(X^{2})_{m} \qquad W^{1} \qquad Y^{1} \qquad R^{5}-J^{1} \qquad (X^{2})_{m} \qquad W^{1} \qquad Y^{1} \qquad Y^{2} \qquad Y^{2} \qquad Y^{3})_{n} \qquad (30) \qquad (20-1) \qquad R^{5}-J^{1} \qquad (8) \qquad (20-1) \qquad R^{6}-J^{1} \qquad (8) \qquad (20-1) \qquad (20-1$$

一般式 (30) [式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、製造法 A、製造法 B、製造法 F 及び製造法 G と同様な条件下反応させることにより、一般式 (20)、 (20-1)、 (20-2)及び (20-3) [各式中、A, W¹, W², X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

反応式9

5

10

15

一般式 (25) [式中、X², R⁵, R⁶及びmは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と一般式 (13) において R゚が水素原子である一般式 (13-1) [式中、A, Y¹, Y², Y³及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、文献記載の公知の方法、例えばベリヒテ・デア・ドイッチェン・ヘミッシェン・ゲゼルシャフト [Ber. Dtsch. Chem. Ges.] 1907年、40巻、3177頁、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー [J. Chem. Soc.] 1954年、2023頁、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティー・パーキン・トランスアクションズ、1 [J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1] 1994年、2975頁等に記載の方法に準じて反応させることにより、一般式 (20) において W 及び W が酸素原子である一般式 (20-4) [式中、X², Y¹, Y², Y³, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を容易に合成することができる。

製造法 0 において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式(2 1)で表される化合物は、次のようにして合成できる。 反応式 1 0

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{4}
 Y^{5}
 Y^{5}
 Y^{5}
 Y^{6}
 Y^{7}
 Y^{8}
 Y^{8

すなわち、一般式 (16) において R¹が水素原子である一般式 (16-3) [式中、A, W¹, X², Y¹, Y², Y³, R⁵, R⁶, m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の一般的な脱水環化によるイソイミドの合成反応、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1975年、97巻、5582頁、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1967年、10巻、982頁、ザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1963年、28巻、2018頁等に記載の方法等に準じて環化することにより容易に合成することができる。

製造法 P において、本発明化合物を製造するための原料化合物である、一般式 (2 10 2) で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式11

15

$$(X^{2})_{m}$$
 COOH $(X^{2})_{m}$ O $(X^{2})_{$

すなわち、一般式(1 2)において X^1 が X^1 -1 であり、G が G-1 且つ R^2 が水素原子である一般式(1 2-3) [式中、 W^2 , X^2 , R^3 , R^5 , R^6 及び m は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、反応式 1 0 と同様に反応させることにより容易に合成することができる。

反応式 1、反応式 4 及び反応式 9 で用いられる一般式 (25) [式中、X², R⁵, R⁶ 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。 反応式 12

COOR

COOR

$$(X^2)_m$$

COOH

 $(X^2)_m$

COOH

 $(X^2)_m$

COOH

 $(X^2)_m$
 $($

すなわち、一般式 (32) [式中、X², R⁵, R⁶及びmは前記と同じ意味を表し、R はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。] で表される化合物を、文献記載の一般的な加水分解反応、例えばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1929年、51巻、1865頁、アンゲバンテ・ヘミー[Angew. Chem.] 1951年、63巻、329頁等に記載の方法に準じて一般式 (33)[式中、X², R⁶, R⁶及びmは前記と同じ意味を表す。] で表されるフタル酸誘導体とした後、文献記載の一般的な脱水環化反応、例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1987年、52巻、129頁等に記載の方法に準じた条件下反応させることにより、一般式 (25)で表される化合物を得ることができる。反応式3で用いられる一般式 (26)[式中、X², R³, R⁶, R⁶, m及び J⁶は前記と

反応式3で用いられる一般式(26) [式中、 X^2 , R^3 , R^6 , R^{6a} , R^{6b} , m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式13

5

10

15

すなわち、一般式(3 4) [式中、 X^2 , R^3 , R^5 , m及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(9) [式中、 R^{6a} 及び R^{6b} は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物又は一般式(1 0) [式中、 R^{6a} , R^{6b} , J^2 及び J^3 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 C 又は製造法 D と同様な条件下反応させることに

より、一般式(26)で表される化合物を得ることができる。

反応式 6 で用いられる一般式(28) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m 及び n は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。

反応式14

$$(X^{2})_{m} \qquad \qquad (X^{2})_{m} \qquad \qquad (X^{2})_{m}$$

5 すなわち、一般式(35) [式中、A, X², Y¹, Y², Y³, m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を、文献記載の一般的なニトロ基の還元反応、例えばジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー [J. Med. Chem.] 1991年、34巻、2209頁等記載のパラジウム、プラチナ触媒等を用いた接触還元、例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1998年、39巻、201頁等記載のスズ、鉄等の低原子価金属塩を用いた還元、等に準じた条件下反応させることにより、一般式(28)で表される化合物を得ることができる。

反応式7で用いられる一般式(29) [式中、X², R⁵, R⁶及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも次のようにして容易に合成できる。

15 反応式15

COOR

$$R^{5}-J^{1}$$
 $R^{5}-N$
 $R^{5}-N$

すなわち、公知の一般式(36) [式中、 X^2 及び \mathbf{n} は前記と同じ意味を表し、 \mathbf{R} はメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。]で表される化合物と、一般式(7) [式中、 \mathbf{R}^5 及び \mathbf{J}^1 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 \mathbf{A} と同様な条件下反応させることにより、一般式(37) [式中、 \mathbf{X}^2 、 \mathbf{R}^5 、 \mathbf{n} 及び \mathbf{R} は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式(37)で表される化合物と、一般式(8) [式中、 R^6 及び I は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 B と同様な条件下反応させることにより、一般式(38) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 , m 及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

このようにして得られた一般式(37)及び一般式(38)で表される化合物は、通常の安息香酸エステル類の加水分解反応条件下、容易に一般式(29-1) [式中、 X^2 , R^5 及び π は前記と同じ意味を表す。]及び一般式(29-2) [式中、 X^2 , R^5 , R^6 及び π は前記と同じ意味を表す。]で表される対応するカルボン酸誘導体に変換できる。

反応式8で用いられる一般式 (30) で表される化合物の或るものはヨーロッパ特許 出願公報 (EP 0,919,542号公報、EP 1,006,107号公報、)、国際特許出願公報 (WO 01/00599号公報、WO 01/21576号公報)等に記載の公知化合物であり、また、それ以外 のものも、これらの合成方法及び文献記載のアニリン誘導体の一般的な合成方法に準じ

て対応する置換フタル酸イミド誘導体から容易に合成することができる。

反応式12で用いられる一般式(32) [式中、X2, R5, R6及びmは前記と同じ意味を 表し、Rはメチル基、エチル基等の低級アルキル基を表す。]で表される化合物は、次の ようにして合成できる。

5 反応式16

10

$$(X^{2})_{m} \qquad R^{5}-J^{1} \qquad (X^{2})_{m} \qquad R^{6}-J^{1} \qquad (X^{2})_{m} \qquad COOR$$

$$(R^{5}-N) \qquad COOR \qquad (R^{5}-N) \qquad COOR$$

$$(R^{5}-N) \qquad R^{5}-N \qquad R^{6} \qquad (R^{6}-J^{1}) \qquad (R^{6}-J^{1$$

すなわち、一般式 (39) [式中、 X^2 及び $_{\rm II}$ は前記と同じ意味を表し、Rはメチル基、 エチル基等の低級アルキル基を表す。]で表される化合物と、一般式(7)[式中、R5 及び J'は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反 応させることにより、一般式(32-1) [式中、 X^2 , R^5 , m及びRは前記と同じ意味を表 す。〕で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式(32-1)で表される化合物と、一般式(8) [式中、 $m R^6$ 及び $m J^1$ は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 B と同様な条件下反応させ ることにより、一般式 (32-2) [式中、X2, R5, R6, m及び R は前記と同じ意味を表 す。] で表される化合物を得ることができる。

ここで、用いられる一般式(39)で表される化合物の或るものは公知化合物(例え 15 ばジャーナル・オブ・ジ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティー[J. Am. Chem. Soc.] 1929年、51巻、1865頁等に記載の化合物。)であり、また、それ以外のもの も文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

反応式13で用いられる一般式 (34) [式中、X², R³, R⁵, m及び J⁵は前記と同じ意 味を表す。] で表される化合物は、例えば下記の反応式17又は反応式18で表される 20 方法等を用いて合成できる。

反応式17

$$(X^{2})_{m} J^{6} (X^{2})_{m} J^{6} (X^{2})_{m} J^{6} (40) (41) (41) (41) (47-1) (17-1) (17-1) (X^{2})_{m} J^{6} (17-1) (X^{2})_{m} J^{6} (7)$$

すなわち、一般式(40)[式中、 X^2 , m及び J^6 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(17)において R^2 が水素原子である一般式(17-1)[式中、 R^3 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 H と同様な条件下反応させるか、或いは一般式(40)で表される化合物を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボン酸クロライドした後に一般式(17-1)で表される化合物と反応させることにより、一般式(42)[式中、 X^2 , R^3 , m及び J^6 は前記と同じ意味を表す。]で表される化合物を得ることができる。

この一般式 (42) で表される化合物は、反応式 14 と同様な条件下反応させることにより、一般式 (43) [式中、 X^2 , R^3 , m 及び J^6 は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

さらに、この一般式 $(4\ 3)$ で表される化合物と、一般式 (7) [式中、 \mathbb{R}^5 及び \mathbb{J}^1 は 前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 \mathbb{A} と同様な条件下反応させる ことにより、一般式 $(3\ 4)$ で表される化合物を得ることができる。

また、一般式(43)で表される化合物は、一般式(41) [式中、X²、m及び J⁶ は前 記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(17-1)で表される化合物とを、 一般式(40)で表される化合物の場合と同様に反応させることによっても得ることが できる。 ここで、用いられる一般式(40)で表される化合物及び一般式(41)で表される化合物の或るものは公知化合物(例えばザ・ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー[J. Org. Chem.] 1952年、17巻、167頁及び1954年、19巻、510頁等に記載の化合物。)であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

反応式18

すなわち、一般式(44) [式中、X², m, J⁶及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物と、一般式(7) [式中、R⁵及び J¹は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物とを、製造法 A と同様な条件下反応させることにより、一般式(45) [式中、10 X², R⁵, m, J⁶及び R は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。この一般式(45)で表される化合物は、通常の安息香酸エステル類の加水分解反応条件下、容易に一般式(46) [式中、X², R⁵, m及び J⁶は前記と同じ意味を表す。] で表される対応するカルボン酸誘導体に変換できる。

さらに、この一般式(46)で表される化合物と、一般式(17)において R²が水素 15 原子である一般式(17-1) [式中、R³は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物 とを、製造法 H と同様な条件下反応させるか、或いは一般式(44)で表される化合物 を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボ

10

15

ン酸クロライドした後に一般式 (1 7-1) で表される化合物と反応させることにより、 一般式 (3 4) で表される化合物を得ることができる。

ここで、用いられる一般式(44)で表される化合物の或るものは公知化合物(例えばテトラヘドロン・レターズ [Tetrahedron Lett.] 1993年、34巻、3083頁等に記載の化合物。)であり、また、それ以外のものも文献記載の公知の方法を用いて容易に合成することができる。

反応式14で用いられる一般式(35) [式中、A, X^2 , Y^1 , Y^2 , Y^3 , m及びnは前記と同じ意味を表す。] で表される化合物は、次のようにして合成できる。 反応式19

すなわち、公知の一般式(47) [式中、 X^2 及びmは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物と、一般式(13)において R^1 が水素原子である一般式(13-1) [式中、A, Y^1 , Y^2 , Y^3 及びnは前記と同じ意味を表す。]で表される化合物とを、製造法 Hと同様な条件下反応させるか、或いはを、一般式(47)で表される化合物を、塩化チオニル又はオキザリルクロライド等のクロル化剤を用いて、対応するカルボン酸クロライドした後に、一般式(13-1)で表される化合物と反応させることにより、一般式(35)で表される化合物を得ることができる。

これらの各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより、製造法 A ~S の原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

またこれらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、 20 それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

本発明に包含される化合物としては、具体的に例えば、第1表~第6表に示す化合物 が挙げられる。但し、第1表~第6表の化合物は例示のためのものであって、本発明は

10

これらのみに限定されるものではない。

尚、表中 Et との記載はエチルを表し、以下同様に n-Pr 及び Pr-n はノルマルプロピルを、i-Pr 及び Pr-i はイソプロピルを、c-Pr 及び Pr-c はシクロプロピルを、n-Bu 及び Bu-n はノルマルブチルを、s-Bu 及び Bu-s はセカンダリーブチルを、i-Bu 及び Bu-i はイソブチルを、t-Bu 及び Bu-t はターシャリーブチルを、c-Bu 及び Bu-c はシクロブチルを、n-Pen 及び Pen-n はノルマルペンチルを、c-Pen 及び Pen-c はシクロペンチルを、n-Hex 及び Hex-n はノルマルヘキシルを、c-Hex 及び Hex-c はシクロヘキシルを、Ph はフェニルを、Naph はナフチルをそれぞれ表し、

表中 T-1~T-24 は、それぞれ下記の構造を表し、

T-1:
$$\begin{array}{c} Cl \\ \hline \\ T-2: \\ \hline \end{array}$$
 $\begin{array}{c} Br \\ \hline \\ T-3: \\ \hline \\ CH_3 \\ \end{array}$

$$T-4: \begin{array}{c} Cl \\ \hline CH_2SCH_3 \end{array}$$

$$T-6: \begin{array}{c} CH_2SCH_3 \\ \hline CH_3 \end{array}$$

T-7:
$$CH_2S(O)CH_3$$
 T-8: $CH_2SO_2CH_3$ T-9: CH_2SCH_3

T-10:
$$CH_2OH$$
 T-11: CH_2SCH_3 T-12: $CH_2S(O)CH_3$

T-13:
$$CH_2SO_2CH_3$$
 T-14: $T-15:$ $T-15:$

T-16:
$$-N$$

COOEt

COOEt

COOEt

 $T-18: -N$
 $T-18: -N$

COOEt

T-19:
$$-N$$

$$T-20: -N$$

$$T-21: -N$$

$$T-22:$$
 $-N$ $T-23:$ $-N$ O $T-24:$ $-N$ S

表中 L-1a~L-48c で表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

L-1a:
$$-2a:$$
 L-3a: $-3a:$

L-4a:
$$-\mathbf{N}$$
 L-14b: $-\mathbf{N}$ CF₃

L-19a:
$$CH_3$$
 L-20a: CH_3 L-21a: CH_3

L-22a:
$$CH_3$$
 L-22b: CF_3 L-23a: CH_3

L-24a:
$$-N$$

CF₃

L-36a: $-N$

CH₃

CH₃

さらに、表中 M-4a~M-24a で表される脂肪族複素環は、それぞれ下記の構造を表す。

M-4a:
$$\longrightarrow$$
 M-5a: \longrightarrow M-8a: \longrightarrow S

M-9a: \longrightarrow S

M-9b: \longrightarrow S

M-9c: \longrightarrow SO₂

M-16a: \longrightarrow O

M-19a: \longrightarrow S

M-22a: \longrightarrow N-CHO

M-22b: \longrightarrow N-C

CH₃

M-22c: \longrightarrow N-C

CF₃

M-22d: \longrightarrow N-C

OCH₃

また、表中、置換基 $(X^2)_m$ 、 $(Y^3)_n$ 及び置換基 $(R^4)_p$ の置換位置を表す番号は、それぞ

れ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

第1表

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{H} \xrightarrow{(X^{2})_{m}} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} \xrightarrow{U} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{U} (Y^{3})$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{|I|} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{|I|} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{$$

$$Y^{1}$$
 Y^{2}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$\downarrow 0$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{|I|} (Y^{3})_{1}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{|I|} (Y^{3})_{1}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 5 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

$$C \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

[1] - 72

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{r}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{r}$$

$$\downarrow 0$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{N} \\ \text{N} \\ \text{N} \\ \text{OEt} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 1 \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 1 \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 1 \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{N} \\ \text{O} \\ \text{O}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{n}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})$$

$$(X^{3})_$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 5 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{II} \\ \text{II}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{II} \\ \text{CH}_{3} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{II} \\ \text{C} \\ \text{C} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{C} \\ \text{C} \\ \text{C} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{C} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{C} \\ \text{C} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ \text{C} \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 5 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m} (Y^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m} (Y^{3})_{m} \xrightarrow{\downarrow \downarrow} (Y^{3})_{m} (Y^{3}$$

$$(X^{2})_{m} \xrightarrow{\begin{array}{c} 1 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 3 \\ 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 3 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 1 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 5 \\ 1 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6 \\ 1 \end{array}} \xrightarrow{\begin{array}{c} 6$$

$$Y^{1}$$
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

$$CH_3$$
 CH_3
 CH_3

	(X ²) _m	R ³	Y1 Y2	(Y³) _n
5	——— H	CH ₃	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH ₃	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₃	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	CH ₃	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH ₃	CH_3 $O(L-45d)$	H
10	H	Et	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	Et	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	Et	CH_3 0 (L-45d)	H
15	H	n-Pr	F $C(CF_3)_2OH$	Н
	H	n-Pr	$C1$ $CF (CF_3)_2$	H
	H	n-Pr	Cl OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	Br $CF(CF_3)_2$	H
	H	n-Pr	CH_3 CF $(CF_3)_2$	H
20	H	n-Pr	$\mathrm{CH_3}$ C (CF ₃) $_2\mathrm{OH}$	Н
	H	n-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	n-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	H
	H	n-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	H
	H	n-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFBr	H
25	H	n-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	n-Pr	CH_3 $O(L-45d)$	H
	H	n-Pr	Et $C(CF_3)_2OH$	H
	H	n-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H H	H
30	H	i-Pr	H H	3-F
	H	i-Pr	H H	3-C1
	H	i-Pr	н н	3-Br
	H	i-Pr	н н	3-CH ₃
	H	i-Pr	н н	3-CF ₃

PCT/JP02/07833 WO 03/011028 135

	H	i-Pr	н н з	OCII
				-0CH ₃
	H	i-Pr		OPr-i
	H	i-Pr		OCHF ₂
	H	i-Pr		−SCH₃
5	H	i-Pr	. Н Н 3	-SCF ₃
	H	i-Pr	H Н 3-S (0) CF ₃
	H	i-Pr		-19a)
	H	i-Pr		-22b)
	H	i-Pr		5-Cl ₂
10	H	i-Pr	$^{\rm H}$ $^{\rm H}$ $^{\rm H}$ $^{\rm 3-CF_3-5}$	
10	H	i-Pr	H F	
				Н
	H	i-Pr	H F	3-F
	H	i-Pr	H F	3-C1
	H	i-Pr	H C1	H
15	H	i-Pr	H C1	3-C1
	H	i-Pr		3-CF ₃
	H	i-Pr	H C1 3-0 (L	-45d)
	H	i-Pr	H Br	Н
	H	i-Pr		3-CH ₃
20	H	i-Pr	H I	H
	H	i-Pr	H CH ₃	H
	H	i-Pr	H Et	H
	H	i-Pr	H Pr-n	Н
0.5	H	i-Pr	H Pr-i	H
25	H	i-Pr	H Bu-n	H
	H	i-Pr	H Bu-t	H
	H	i-Pr	H CF ₃	H
	Н	i-Pr	$H \qquad CF_2CF_3$	H
	H	i-Pr	H CF_2CF_3	3-C1
30	H	i-Pr	$H \qquad CF_2CF_3$	3-CH ₃
	H	i-Pr	H $CF_2CF_2CF_3$	Н
	H	i-Pr	H $CF(CF_3)_2$	H
	H	i-Pr	H CF (CF ₃) ₂	3-F
	H	i-Pr	H CF (CF ₃) ₂	3-C1
35	H	i-Pr		-SCH ₃
00	H	i-Pr	H CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	H C (CF ₃) ₂ OH	H
	H			
		i-Pr	H C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
40	H	i-Pr	H T-1	H
40	H	i-Pr	H T-2	H
	H	i-Pr	H T-3	H
	H	i-Pr	H T-4	H
	H	i-Pr	H T-5	H
	H	i-Pr	H $CH_2ON=C (Pr-c) Ph-4-C1$	H
45	H	i-Pr	H OCH ₃	Н
	H	i-Pr	H OCHF ₂	H
	H	i-Pr	H OCHF ₂	3-F
	11	1 11	II UVIII 2	o r

			100	
	H	i-Pr	H OCHF ₂	3-C1
	H	i-Pr	H OCHF ₂	3-CF ₃
	H	i-Pr	H OCHF ₂	3-0CH ₃
	H	i-Pr	, -	B-OCHF ₂
5	H	i-Pr		3, 5-Cl ₂
	Н	i–Pr	H OCF ₃	, o or ₂ H
	H	i-Pr	<u> </u>	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	H OCF ₂ CHFOCF ₃	5, 5 61 ₂ H
	H	i-Pr	H OCF ₂ CHFOCF ₃	3-C1
10	H	i-Pr	H OCF ₂ CHFOCF ₃ CF ₂ CF ₂ CF ₃	3-01 H
10	H	i-Pr	H OCH (CH ₃) Ph	n H
	H	i-Pr		
	H	i-Pr	.	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr		s, 5-Cl ₂
15	H		H SCHF ₂	Н
10	H	i-Pr	H SCF ₃	H
	п Н	i-Pr	H SCF ₂ Br	H
		i-Pr	H SCH ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	H SCF ₂ CHF ₂	. H
9.0	H	i-Pr	H SCF ₂ CF ₂ Br	. Н
20	H	i-Pr	H SCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	H SCF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	H SCF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	H S (0) CF ₃	H
nΓ	H	i-Pr	$H S(0) CF_2Br$	Н
25	H	i-Pr	H SO ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	H $SO_2N(Et)_2$	H
	H	i-Pr	H NO ₂	H
	H	i-Pr	H C (0) CH ₃	H
0.0	H	i-Pr	$H C (CH_3) = NOCH_3$	H
30	H	i-Pr	$H \qquad C (CH_3) = NOCH_2 CH = CH_2$	Н
	H	i-Pr	H CN	H
	H	i-Pr	H CH=CCl ₂	Н
	H	i-Pr	H CH=CBr ₂	Н
0.5	H	i-Pr	$H = CH = C (C1) CF_3$	Н
35	H	i-Pr	H Ph	H
	H	i-Pr	H L-14c	Н
	H	i-Pr	H L-22b	H
	H	i-Pr	H L-24a	H
	H	i-Pr	H L-36a	H
40	H	i-Pr	H $3-0$ CH ₂ $0-4$	
	H	i-Pr	$H \qquad \qquad 3-0CF_2O-4$	
	H	i-Pr	H $3-0$ CF ₂ CF ₂ -4	
	H	i-Pr	H $3-0$ CHFCF ₂ $0-4$	
	H	i-Pr	H $3-0$ CF $_2$ CHF $0-4$	
45	H	i-Pr	H $3-0$ CF $_2$ CF $_2$ 0 -4	
	H	i-Pr	$H \qquad \qquad 3-0CF_2OCF_2-4$	
	H	i-Pr	H $3-0C (CF_2 CF_3) = N-4$	

PCT/JP02/07833 WO 03/011028 137

	Н Н Н	i-Pr i-Pr i-Pr	H $3-0C (CF_2 CF_2 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3$	-4
c	H	i-Pr	$H \qquad \qquad 3-N=C (CF_2 CF_2 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3 CF_3$	
5	H H	i-Pr	H 3-N=C (Ph-4-CF ₃)	0-4
	n H	i-Pr i-Pr	H $3-SC (Pr-i) = N-4$ H $3-N=C (CF_3) NH-4$	
	H	i-Pr		١ ،
•	H	i-Pr	H $3-N=C$ (CF ₃) N (CH ₃) F H	
10	H	i-Pr	F H	H 5-F
	H	i-Pr	F F	J-r H
	H	i-Pr	F F	3-F
	H	i-Pr	F F	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr		$5, 6-F_3$
15	H	i-Pr	F Cl	H
	Н	i-Pr	F Br	5-CF ₃
	H	i- P r	$F \qquad CF_2CF_3$	H
	H	i-Pr	$F CF_2CF_2CF_3$	Н
	H	i-Pr	F CF (CF ₃) ₂	H
20	H	i-Pr	F $C (CF_3)_2 OH$	H
	H	i-Pr	F $C (CF_3)_2 OCH_3$	H
	H	i–Pr	F OCF ₃	Н
	H	i-Pr	F OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
0.5	H	i-Pr	$F = 0 (Ph-2-C1-4-CF_3)$	Н
25	H	i-Pr	F 0 (L-45d)	Н
	H H	i-Pr	$F \qquad S (Ph-2-CI-4-CF_3)$	5-C1
	n H	i-Pr i-Pr	F 4-0CF ₂ 0-5 Cl H	11
	H	i-Pr	Cl H Cl H	3-C1
30	H	i-Pr	Cl H	3-C1 5-C1
00	H	i-Pr	CI H	6-C1
	H	i-Pr	C1 F	H
	H	i-Pr	ci ci	H
•	H	i-Pr	C1 C1	3-C1
35	H	i-Pr	Cl CH ₃	H
	H	i-Pr	Cl CF ₃	H
	H	i-Pr	C1 CF ₃	6-C1
	H	i-Pr	$C1 \qquad CF_2CF_3$	Н
	H	i-Pr	$C1 \qquad CF_2CF_2CF_3$	H
40	H	i-Pr	Cl $CF(CF_3)_2$	H
	H	i-Pr	$C1 \qquad C(CF_3)_2OH$	H
	H	i-Pr	$C1$ $C(CF_3)_2OCH_3$	Н
	H	i-Pr	Cl OCF_3	H
	H	i-Pr	Cl OCF ₂ CHFCF ₃	5-C1
45	H	i-Pr	$C1 \qquad OCF_2 CHFOCF_2 CF_2 CF_3$	H
	H	i-Pr	C1 0 (L-45d)	H
	H	i-Pr	C1 3-0CHFCF ₂ 0-4	

	H	i-Pr	C1 3-0CF ₂ CHF0-4
			<u> = </u>
	H	i-Pr	$C1$ 3-0 CF_2CF_2O-4
	H	i-Pr	C1 3-N=C (CF ₃) 0-4
	H	i-Pr	Cl 4-0CF ₂ 0-5
_			
5	H	i-Pr	4-0CHFCF ₂ $0-5$
	H	i-Pr	C1 4-0CF ₂ CHF0-5
	H	i-Pr	$61 4-00F_2CF_2O-5$
	H		
		i-Pr	C1 3-0CHFCF ₂ 0-4-5-C1
	H	i-Pr	3-0CHFCF ₂ $0-4-6-C1$
10	H	i-Pr	Br H H
	H	i-Pr	Br CF ₂ CF ₃ H
			- _
	H	i-Pr	Br $CF(CF_3)_2$ H
	H	i-Pr	Br $CF(CF_3)_2$ 5-CH ₃
	H	i-Pr	Br $C(CF_3)_2OH$ H
15	H	i-Pr	
10			
	Н	i-Pr	Br OCF ₃ H
	H	i-Pr	Br OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	H	i-Pr	Br 0 (L-45d) H
	H		
		i-Pr	Br 4-0CF ₂ CHF0-5
20	H	i-Pr	Br $4-0$ CHFCF ₂ $0-5-3-B$ r
	H	i-Pr	Br $4-0$ CF ₂ CHF $0-5-3-B$ r
	H	i-Pr	Br 3-0CHFCF ₂ 0-4-5-Br
	H	i-Pr	Br $3-0$ CF ₂ CHF $0-4-5-$ Br
	H	i-Pr	Br 3-OCHFCF ₂ O-4-6-Br
25	H	i-Pr	Br $3-0$ CF ₂ CHF $0-4-6-$ Br
	H	i-Pr	I $4-0$ CF ₂ $0-5$
	H		2
		i-Pr	CH ₃ H H
	H	i-Pr	CH ₃ H 3-F
	H	i-Pr	CH ₃ H 3-C1
30	H	i-Pr	CH ₃ H 3-CH ₃
00	H		
		i-Pr	CH_3 H $3-CF_3$
	H	i-Pr	CH ₃ H 3-OCH ₃
	H	i-Pr	CH_3 H $3-OCHF_2$
	H	i-Pr	CH ₃ H 3-OCF ₂ CHFC1
95			
35	H	i–Pr	CH ₃ H 5-F
	H	i-Pr	CH_3 H 5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ H 5-Br
	H	i-Pr	CH ₃ H 5-CH ₃
	H	i-Pr	CH_3 H $5-CF_2CF_3$
40	H	i-Pr	CH_3 H 5- (L-22a)
	H	i-Pr	CH_3 H 5-0 (L-45d)
	H		-
		i-Pr	CH ₃ H 6-Cl
	H	i-Pr	$\mathrm{CH_3}$ H $6-\mathrm{CH_3}$
	H	i-Pr	CH ₃ F
45	H	i-Pr	CH ₃ Cl H
10			
	H	i-Pr	CH_3 $C1$ $3-CH_3$
	H	i-Pr	CH ₃ C1 5-C1

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

139

	Н	i-Pr	CH ₃ Cl 5-	-0 (L-45d)
	H	i-Pr	CH ₃ Br	Н
	H	i-Pr	CH ₃ Br	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ I	H
Е				H
5	H	i-Pr		3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₃	
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₃	3-0CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₃	3-0CHF ₂
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₃	6-CH ₃
10	H	i-Pr	CH_3 CH_2CH_2Bu-t	H
	H	i-Pr	CH ₃ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH_3 CF_2CF_3	H
	H	i-Pr	$\mathrm{CH_3}$ $\mathrm{CF_2CF_3}$	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH_3 CF_2CF_3	5-C1
15	H	i-Pr	CH ₃ CF ₂ CF ₃	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ CF ₂ CF ₃	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	Н
	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	3-CH ₃
20	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	5-F
20	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) ₂	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ CF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H		CH_3 $CF_2CF_2CF_3$ CH_3 CF (CF_3) CF_2CF_3	H
9.5		i-Pr		H
25	H	i-Pr		H
	H	i-Pr	CH ₃ CF (CF ₃) OCH ₃	
	H	i-Pr	CH_3 C (CF_3) (CH_3) OH	Н
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) (CH ₃) OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	i-Pr	CH_3 C $(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OEt	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OPr-n$	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OPr-i$	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OBu-n$	Н
35	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OHex-n$	Н
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CF_3$	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CH=CF_2$, H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CF=CF_3$	H
40	H	i-Pr	CH_3 C $(CF_3)_2OCH_2CH=CC1$	₂ H
	H	i-Pr	CH_3 $C (CF_3)_2 OCH_2 C \equiv CH$	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) 2 OCH ₂ Ph	H
	H	i-Pr	CH_3 C (CF_3) (CF_2 C1) OH	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)$ (CF_2C1) OCH_3	
45	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)$ (CF_2CF) CH_3	H
40	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)$ (CF_2BF) OCH_3	
				H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)(CF_2CF_3)OH$	п

	H	i-Pr	CH_3 C (CF_3) (CF_2CF_3) OCH_3	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) (Pr-i) OH	H
	H	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) (Pr-i) OCH ₃	Н
	Ĥ	i-Pr	CH_3 C (CF_3) $(Pr-c)$ OH	H
5	H	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)(Pr-c)OCH_3$	H
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₂ SCH ₃	Н
	H	i-Pr	CH ₃ CH ₂ SCF ₃	H
	H	i-Pr	CH_3 CH_2 (Ph-4-C1)	H
	H	i-Pr	CH ₃ CH (Ph-4-C1) OH	H
10	H	i–Pr	CH ₃ OCH ₃	H
10	H	i-Pr	CH ₃ OCH ₃	3-CH ₃
				Н
	H	i-Pr	CH ₃ OPr-i	
	H	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	Н
	H	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	3-C1
15	H	i-Pr	CH_3 $OCHF_2$	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	5-C l
	H	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	6-CH ₃
	H	i–Pr		5-Cl ₂
20	H			H
20		i-Pr	CH ₃ OCF ₃	
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	5-CH ₃
25	H	i-Pr	CH_3 OCF_3 3,	5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	3-C1
	H	i–Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	3-CH ₃
	Н	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	5-C1
9.0				
30	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	5-CH ₃
	Н	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	6-СНз
	H	i-Pr		5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃ OCH ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	H
35	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	6-CH ₃
40	H	i-Pr		, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	5-C1
45	H	i–Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	5-CH ₃
טדי				-
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH_3 OCF_2CHFC1 3,	5-Cl ₂

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

141

	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFBr	7.7
	Н	i-Pr		Н
	H	i-Pr		3-C1
	H		CH ₃ OCF ₂ CHFBr	3-CH ₃
-		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFBr	5-C1
5		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFB _r	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFBr	6-CH ₃
	Н	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Br	
	H	i-Pr		3-C1
10		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Br	5-C1
10	H		CH ₃ OCF ₂ CFCl ₂	H
		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CCl ₃	Н
	H	i-Pr	CH_3 OCH (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCH ₂ CF ₂ CHF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	H
15	Н	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	
	H	i-Pr		3-C1
	H	i-Pr	- 2 	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	5-C1
	H		CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	5-CH ₃
9.0		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	6−CH ₃
20	H	i-Pr	CH_3 OCF ₂ CHFCF ₃	3, 5-Cl ₂
	Н	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCH ₂ OCH ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	Н
25	H	i-Pr		3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	3-CH ₃
	H		CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	5-C1
		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH_3 $OCF_2CHFOCF_3$	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	3, 5-Cl ₂
30	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-C1
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr		5-C1
35	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-CH ₃
00	H		CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	6-CH3
		i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃ OCH ₂ SCH ₃	H
	Н	i-Pr	CH_3 OC $(CF_2CF_3) = C(CF_3)_2$	H
	H	i-Pr	$CH_3 \qquad OC (OCH_3) = C (CF_3)_2$	H
40	H	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Ph	
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (Ph-2-C1)	H
	H	i-Pr		Н
	H		CH ₃ 0 (Ph-3-C1)	Н
	H	i-Pr : D∽	CH_3 $O(Ph-4-C1)$	Н
4E		i-Pr	CH_3 0 (Ph-3-CF ₃)	Н
45	H	i-Pr	CH_3 $O(Ph-4-CF_3)$	Н
	H	i-Pr	CH_3 O $(Ph-3-CN)$	H
	H	i-Pr	CH_3 $O(Ph-2-Cl-4-CF_3)$	H
			-3 - 1 - 1 01 3/	11

			* ***	
	H	i-Pr	$CH_3 OC_6F_5$	Н
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45b)	Н
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45c)	H
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45c)	3-C1
5	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45c)	5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45c)	3, 5-Cl ₂
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45d)	0, 0 C1 ₂
	H	i-Pr	CH_3 0 (L-45d)	3-C1
	H	i-Pr	CH_3 0 (L-45d)	3-CH ₃
10	Н	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45d)	5-C1
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45d)	5-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45d)	
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45d)	6-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-48a)	3, 5-Cl ₂
15	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-48b)	H
	H	i-Pr	CH ₃ 0 (L-48b)	H
	H	i-Pr		H
	H	i-Pr		H
	H	i-Pr		H
20	H	i-Pr	$CH_3 \qquad \qquad 4-CF_2CF_2O-5$	
20	H	i-Pr	CH ₃ 4-0CF ₂ 0-5	
	Н	i-Pr	CH ₃ 4-0CHFCF ₂ 0-5	
	H	i-Pr	$CH_3 \qquad 4-0C (CF_3) = N-5$	
	H	i-Pr	CH ₃ SF ₅	H
25	H	i-Pr	CH ₃ SCH ₃	H
20	H	i-Pr	CH ₃ SCH ₃	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH ₃ SPr-i	H
	H	i-Pr	CH ₃ SCHF ₂	Н
	H	i-Pr	CH ₃ SCF ₃	Н
30	H	i-Pr	CH ₃ SCF ₂ Br	H
00	H	i-Pr	CH ₃ SCF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	CH ₃ SCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	H
	H	i-Pr	CH ₃ S (Ph-3-C1)	H
35	H	i-Pr	CH ₃ S (Ph-4-C1)	H
00	H	i-Pr	CH ₃ S (0) CF ₃	Н
	H	i-Pr	CH ₃ SO ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CF=CF ₂	Н
	H		CH_3 S (0) $CH_2CH_2CF=CF_2$	H
40	H	i-Pr	CH_3 $SO_2CH_2CH_2CF=CF_2$	Н
40		i-Pr	CH ₃ NO ₂	H
	H	i-Pr	$CH_3 NO_2$	3-CH ₃
	H	i-Pr	CH_3 N (CH_3) C (0) CF_3	H
	H	i-Pr	CH_3 N (CH_3) C (0) CF_2CF_3	H
4.5	H	i-Pr	CH_3 N (CH_3) C (0) $CF_2CF_2CF_3$	H
45	H	i-Pr	$\mathrm{CH_3}$ C (0) $\mathrm{CF_3}$	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(0)$ $Ph-4-C1$	H
	H	i-Pr	CH_3 $C(CH_3) = NOCH_3$	H

PCT/JP02/07833 WO 03/011028

			143		
	Н	i-Pr	CH ₃	C (Ph-4-C1) = NOH	H
	H	i-Pr	CH ₃	$C (Ph-4-C1) = NOCH_3$	H
	Н	i-Pr	CH ₃	C (0) OCH ₃	H
	Н	i-Pr	CH ₃	C (0) OCH ₂ CF ₃	H
5	Н	i-Pr	CH ₃	$C (0) N (CH_3) Ph-4-C1$	H
	H	i-Pr	CH ₃	CN	H

H CH₃ C≡CBu-t Н i-Pr H C≡CPh H i-Pr CH₃ H H CH₃ $C \equiv C (Ph-2, 4-Cl_2)$ i-Pr H Ph-4-C1 i-Pr CH₃ 10 H H Ph-4-CF₃ H i-Pr CH₃ Н Ph-4-0CF₃ H i-Pr CH₃

35

L-14c H СНз H i-Pr H L-22a H i-Pr CH₃ L-24a H 15 H i-Pr CH₃ L-36a H H i-Pr CH₃ H H i-Pr CH₃ Si(CH₃)₃

H СНз Si (CH₃)₂Bu-t H i-Pr Si (CH₃)₂Ph H Н i-Pr CH₃ CH₃ P(0) (0Et) 2 H 20 Н i-Pr H Н Εt H i-Pr

H 5-F H i-Pr Et Εt H 6-E t i-Pr Н Εt H 3-C1-6-Et H i-Pr

25 i-Pr Εt Cl H H H Н i-Pr Et I H Et CF₂CF₃ Н i-Pr CF (CF₃)₂ H i-Pr Εt Н

C (CF₃)₂OH H H i-Pr Et H Εt C (CF₃) 20CH₃ 30 Н i-Pr H Et OCF₃ H i-Pr

H Et OCF₂Br Н i-Pr H i-Pr Et OCF 2 CHFC1 H H Et OCF 2 CHFBr H i-Pr H

Εt OCF 2 CHFCF 3 H i-Pr OCF 2 CHFOCF 3 H H i-Pr Et Εt OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H H i-Pr 0 (L-45d) H Et H i-Pr

H n-Pr H i-Pr Ι H C (CF₃)₂OH 40 n-Pr H i-Pr Н OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H i-Pr n-Pr

H H i-Pr i-Pr i-Pr CF (CF₃)₂ H i-Pr Н i-Pr $C(CF_3)_2OH$ H H i-Pr H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 45 H i-Pr i-Pr H H i-Pr i-Pr 0 (L-45d)

Н i-Pr n-Bu I

Н

	H	i-Pr	CF ₃ H	H
	H	i-Pr	CF ₃ C1	H
	H	i-Pr	CF ₃ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CF ₃ OCHF ₂	Н
5	H	i-Pr	CF ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃ Br	H
	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	осн _з н	H
	H	i-Pr	осн _з н	5-Ph
10	H	i-Pr	OCH ₃ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	OCH ₃ CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	OCH_3 $C(CF_3)_2OH$	H
	H	i-Pr	OCH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₃	H
15	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ Br	H
	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFC1	H
	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFBr	H
	Н	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	H
20	H	i-Pr	OCH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	i-Pr	OCH_3 $O(L-45d)$	Н
	H	i-Pr	OEt CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	$0Et$ C (CF ₃) $_2OH$	Н
	H	i-Pr	OEt OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	i-Pr	0Et 0 (L-45d)	H
	H	i-Pr	OPh CF (CF $_3$) $_2$	H
	H	i-Pr	OPh C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	OPh OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	OPh 0 (L-45d)	H
30	H	i-Pr	SCH ₃ H	H
	H	i-Pr	SCH ₃ CF ₂ CF ₃	Н
	H	i-Pr	SCH ₃ CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	SCH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	i-Pr	SCH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
35	H	i-Pr	SCH_3 0 (L-45d)	H
	H	i-Pr	Ph $CF(CF_3)_2$	H
	H	i-Pr	$L-14a$ C (CF ₃) $_2$ OH	H
	H	i-Pr	L-14b CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	$2-(CH_2)_4-3-4-CF(CF_3)_2$	
40	Н	i-Pr	2-0CF ₂ 0-3	
	H	i–Pr	2-0CF ₂ 0-3-6-C1	
	H	i-Pr	$2-N=CHS-3-4-CF$ (CF $_3$) $_2$	
	4-F	i-Pr	CH_3 CF $(CF_3)_2$	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
45	4-F	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) ₂ OEt	H
	4-F	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CF_3$	Н

	4-F	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) 20CH ₂ CH=CH ₂	Н
	4-F	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CH=CF_2$	H
	4-F	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2CF=CF_2$	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) 2 OCH ₂ CH=CCl ₂	Н
5	4–F	i-Pr	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_2C \equiv CH$	Н
U	4-F	i-Pr	CH ₃ C (CF ₃) 20CH ₂ Ph	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	3-C1
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	3-CH ₃
10		i-Fr	CH ₃ OCHF ₂	5-C1
10	4-F			5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCHF ₂	6-CH ₃
	4-F	i-Pr		3, 5-Cl ₂
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	Н
15	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	3-01
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	5-C1
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₃	5-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	H
20	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	3-C1
	4-F	i-Pr	CH_3 OCF_2Br	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH_3 OCF_2Br	5-C1
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	5−CH₃
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	$6-CH_3$
25	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	3-C1
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	3-CH ₃
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	5-C1
30	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	5-CH ₃
00	4–F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFBr	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	Н
35	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CFBrCF ₃	H
00	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
			CH_3 $O(P_2CH_2CF_2CF_3)$	H
40	4-F	i-Pr	<u> </u>	H
40	4-F	i-Pr	-	
	4-F	i-Pr	CH ₃ 0 (L-45b)	H
	4-F	i-Pr	$CH_3 0 (L-45c)$	Н
	4-F	i-Pr	CH_3 $O(L-45d)$	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ OSO ₂ CF ₃	H
45	4-F	i-Pr	CH ₃ SF ₅	H
	4-F	i-Pr	CH ₃ SCF ₃	Н
	4-F	i-Pr	CH ₃ SCF ₂ B _r	Н

	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₃	Н
	4-F	i-Pr	CH ₃	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	S (0) CF ₃	H
	4-F	i-Pr	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
5	4-C1	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
U	4-C1	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-C1	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-C1	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	4-C1	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
10	4-C1	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
10	4-C1	i-Pr	CH ₃	OCF 2 CHF CF 3	H
	4-C1	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
		i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-C1	i-Pr	CH ₃	0 (Ph-2-Cl-4-CF ₃)	H
15	4-C1	i-Pr	CH ₃	0 (L-45d)	H
10	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₃	H
	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	4-CH ₃	i-Pr	CH ₃	0 (L-45d)	H
20	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	4-CF ₃	i-Pr	CH ₃	0 (L-45d)	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	5-F	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	5-F	i–Pr	CH3	0 (L-45d)	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	6-F	i-Pr	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
35	6-F	i-Pr	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4, 5-F ₂	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4, 5-F ₂		CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4, 5-F ₂		CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	4, 5-F ₂		CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
40	4, 5-F ₂		CH ₃	0 (L-45d)	Н
	Н	c-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	c-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	c-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₃	Н
45	H	c-Pr	CH3	OCF ₂ Br	H
	H	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ Br	3-C1
	H	c-Pr	CH3	OCF ₂ Br	5-C1
			_		

H C-Pr		IT	o D=	CH ₃	OCE Dr	3, 5-Cl ₂
H				_		
H C-Pr						
5 H c-Pr CH3 OCF2CF2Br H H c-Pr CH3 OCF2CHFCF3 H H c-Pr CH3 OCF2CHFCCF3 H H c-Pr CH3 OCF2CHFCCF2CF2CF3 H H c-Pr CH3 OCF2CHFCCF2CF2CF3 H H c-Pr CH3 C(CF3)2 H 4-C1 c-Pr CH3 C(CF3)20H H 4-C73 c-Pr CH3 C(CF3)20H H 5-F c-Pr CH3 O(L-45d) H 6-F c-Pr CH3 CF(CF3)2 H H n-Bu CH3 CF(CF3)2 H H n-Bu CH3 CF(CF3)2 H H n-Bu CH3 C(F63)20H H H i-Bu CH3 C(CF3)20H H						
H C-Pr	_					
H C-Pr H C-Pr H C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_3 H H C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H H C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H H C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H H C-Pr CH3 CF(CF_3)_2 H H C-CF_3 C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H C-F_5 C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H C-F_6 C-Pr CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H H n-Bu CH3 CF(CF_3)_2 H CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H H n-Bu CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H CH3 OCF_2CHFOCF_2CF_2CF_3 H CH3 CF(CF_3)_2 CH3 CH3 CCHF_2 S-CH3 CCH3 CCH5 CCH5 CCH5 CCH5 CCH5 CCH5 CCH5 CCH5	5					
H C-Pr				-		
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				-		
10						
4-Cl c-Pr		H	c-Pr			
A-CF ₃ C-Pr	10	4-F	c-Pr	_		
S-F C-Pr		4-C1	c-Pr		$C(CF_3)_2OH$	
6-F		4-CF ₃	c-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
15 H n-Bu		5-F	c-Pr	CH ₃	0 (L-45d)	
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$		6-F	c-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	15	H		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				CH ₃		H
H n-Bu				CH ₃		H
H i-Bu				-		H
20 H i-Bu CH3 C (CF3) 20H H H i-Bu CH3 OCF2CHFOCF2CF2CF3 H H i-Bu CH3 O (L-45d) H H CH2Pr-c CH3 C (CF3) 20H H H s-Bu F OCF2CHFOCF2CF2CF3 H H s-Bu C1 CF (CF3) 20H H H s-Bu CH3 CF (CF3) 20H H H s-Bu CH3 C (CF3) 20H H H s-Bu CH3 C (CF3) 20H H H s-Bu CH3 C (CF3) 20CH3 H H s-Bu CH3 OCHF2 H H s-Bu CH3 OCHF2 3-CI H s-Bu CH3 OCHF2 3-CH3 H s-Bu CH3 OCHF2 3-CH3 H s-Bu CH3 OCHF2 5-CI						H
H i-Bu	20				-	H
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				_		
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$						
H S-Bu F OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H 25 H S-Bu C1 CF (CF ₃) ₂ H H S-Bu Br C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OCH ₃ H 30 H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ H H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 3-C1 H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 3-CH ₃ H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 5-C1						
25 H s-Bu H s-Bu H s-Bu C1 CF (CF ₃) ₂ H H s-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H s-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H s-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H s-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H S-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H CH ₃ CF (CF ₃) ₂ CF (CF ₃) CF (CF ₃) ₂ CF (CF ₃) CF (CF ₃) ₂ CF (CF ₃) CF (CF ₃) CF			=			
H S-Bu Br C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ CF (CF ₃) ₂ H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OH H H S-Bu CH ₃ C (CF ₃) ₂ OCH ₃ H 30 H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ H H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 3-Cl H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 3-Cl H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 5-Cl	25					
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	20				C (CF ₂) = OH	
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$					CE (CE 2) -	
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$				_		
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$						
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	20			-		
$egin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	30			-	_	
H S-Bu CH ₃ OCHF ₂ 5-Cl						
A 5 24						-
H s-Bu CH_3 $OCHF_2$ 5- CH_3						5-CH ₃
	0.5					_
00 11 0 24	35			-		_
1 0 24 3						
H s-Bu CH ₃ OCF ₃ 3-C1						
H s-Bu CH ₃ OCF ₃ 5-C1						
H s-Bu CH_3 OCF_3 3, 5-Cl ₂						_
40 H s-Bu CH ₃ OCF ₂ Br H	40					
H s-Bu CH ₃ OCF ₂ Br 3-C1			s-Bu			
H $s-Bu$ CH_3 OCF_2Br $3-CH_3$		H	s-Bu			
H s-Bu CH ₃ OCF ₂ Br 5-Cl		H	s-Bu			
H s-Bu CH ₃ OCF ₂ Br 5-CH ₃		H	s-Bu			
45 H s-Bu CH ₃ OCF ₂ Br 3, 5-Cl ₂	45	H	s-Bu	CH₃	OCF ₂ Br	
H s-Bu CH ₃ OCF ₂ CHF ₂ H			s-Bu	СНз	OCF ₂ CHF ₂	
H S-Bu CH ₃ OCF ₂ CHF ₂ 3-C1				CH ₃		3-C1

PCT/JP02/07833

	Н	s-Bu	СНз	OCF 2 CHF 2	5-C1
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFC1	3-C1
5	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFC1	5-C1
Э			CH ₃	OCF 2 CHFC1	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu		OCF ₂ CHFBr	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	s-Bu	CH₃	OCE CHECE	H
	Н	s-Bu	CH3	OCF 2 CHFCF 3	
10	H	s-Bu	CH3	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1
15	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	5-C1
	H	s-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3, 5-Cl ₂
	H	s-Bu	CH ₃	0 (L-45d)	H
	H	s-Bu	CH ₃	0 (L-45d)	3-C1
	H	s-Bu	CH ₃	0 (L-45d)	5-C1
20	H	s-Bu	CH ₃	0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂
20		s-Bu	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H H
	H		CH ₃	SF ₅	H
	H	s-Bu	_		H
	H	s-Bu	Et Et	CF ₂ CF ₃	H
	H	s-Bu		C (CF ₃) ₂ OH	H
25	H	s-Bu	Et	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	s-Bu	Et	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
	H	s-Bu	Et	0 (L-45d)	H
	H	s-Bu	ОСН з	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	OCH 3	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	s-Bu	OCH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	Н
	H	s-Bu	OCH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	s-Bu	ОСН 3	0 (L-45d)	H
	H	s-Bu	0E t	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	0E t	$C(CF_3)_2OH$	Н
35	H	s-Bu	0E t	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
00	H	s-Bu	0E t	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	s-Bu	0E t	0 (L-45d)	H
	H	s-Bu	SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	s-Bu	SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
4.0			SCH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
40	H	s-Bu	•		H
	4-F	s-Bu	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	
	4-C1	s-Bu	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	$4-\mathrm{CF}_3$	s-Bu	СНз	0 (L-45d)	H
	5-F	s-Bu	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
45	6-F	s-Bu	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	3-F

	**	4 D.,	H 3-0CF ₂ 0-4	
	H	t-Bu		
	H	t-Bu	H $3-0$ CHFCF ₂ $0-4$	
	H	t-Bu	H $3-0$ CF ₂ CHF $0-4$	
	H	t-Bu	$H \qquad \qquad 3-0CF_2CF_2O-4$	
5	H	t-Bu	$H 3-OC (CF_2CF_3) = N-$	
	H	t-Bu	H $3-N=C (CF_2CF_3) 0-$	4
	H	t-Bu	H $3-N=C$ (CF ₂ CF ₂ CF ₃) 0-4
	H	t-Bu	$H \qquad \qquad 3-N=C (Ph-4-CF_3)$	0-4
	H	t-Bu	F $CF(CF_3)_2$	H
10	H	t-Bu	F OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	H	t-Bu	F 4-0CF ₂ 0-5	
	H	t-Bu	C1 CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	C1 OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	t-Bu	$3-0$ CF $_2$ CF $_2$ CF $_2$ 0-4	
1 0	H	t-Bu	$3-N=C (CF_3) 0-4$	
15			$\begin{array}{ccc} C1 & & & & & & & & & & & \\ C1 & & & & & & & & & & \\ & & & & & & & & $	
	H	t-Bu	$\begin{array}{ccc} C1 & 4-0CF_2CF_3 \\ C1 & 4-0CF_2CF_2O-5 \end{array}$	
	H	t-Bu		Н
	H	t-Bu	Br CF ₂ CF ₃	
	H	t-Bu	Br OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
20	H	t-Bu	CH ₃ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃
	H	t–Bu	CH ₃ CF ₂ CF ₃	5-C1
	H	t-Bu	CH_3 CF_2CF_3	5-CH ₃
	H	t–Bu	CH_3 $CF(CF_3)_2$	Н
	H	t–Bu	CH_3 $CF(CF_3)_2$	3-CH ₃
25	H	t–Bu	CH_3 $CF(CF_3)_2$	5-F
	H	t-Bu	CH_3 $C(CF_3)_2OH$	H
	H	t-Bu	CH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	3-C1
30	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	$3-CH_3$
	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	5-C1
	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	5-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃ OCHF ₂	3, 5-Cl ₂
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₃	H
35	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₃	3-C1
00	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₃	5-C1
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₃	3, 5-Cl ₂
		t-Bu	CH ₃ OCF ₂ Br	H
	H		CH ₃ OCF ₂ Br	3-C1
40	H	t-Bu	<u> </u>	3-CH ₃
40	H	t-Bu	· ·	5-Cl
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ Br	
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ Br	5-CH ₃
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	H	t–Bu	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	Н
45	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	3-C1
	H	t–Bu	CH ₃ OCF ₂ CHF ₂	5-C1
	H	t-Bu	$CH_3 OCF_2CHF_2$	3, 5-Cl ₂

	**			
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	H
	H	t–Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	3-C1
	H	t–Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	5-C1
	H	t–Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFC1	3, 5-Cl ₂
5	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFB _r	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CFBrCF ₃	Н
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₃	Н
10	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHF0CF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHF0CF ₂ CF ₂ CF ₃	
	H	t-Bu		3-C1
	H	t-Bu	CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-C1
1 5			CH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂
15	H	t-Bu	CH ₃ 0 (L-45d)	Н
	H	t-Bu	CH_3 0 (L-45d)	3-C1
	H	t-Bu	CH_3 0 (L-45d)	5-C1
	H	t-Bu	CH_3 0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂
	H	t-Bu	CH_3 OSO_2CF_3	H
20	H	t–Bu	CH ₃ SF ₅	Н
	H	t-Bu	CH ₃ SCF ₃	H
	H	t-Bu	CH_3 SCF_2Br	H
	H	t-Bu	CH_3 S (0) CF_3	Н
	H	t-Bu	CH ₃ SO ₂ CF ₃	Н
25	H	t-Bu	CH ₃ 4-OCHFCF ₂ O-5	
	H	t-Bu	Et CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	Et C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	Et C(CF ₃) ₂ OCH ₃	Н
	H	t-Bu	Et OCF ₃	H
30	H	t-Bu	Et OCF ₂ Br	H
•	Ĥ	t-Bu	Et OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	H	t-Bu	$\begin{array}{ccc} \text{Et} & \text{OUP}_2 \text{CHPOUP}_2 \text{CP}_2 \text{CP}_3 \\ \text{Et} & \text{O} \left(\text{L} - 45 \text{d} \right) \end{array}$	Н
	H	t-Bu		H
	H	t-Bu		H
35			CF ₃ CF ₂ CF ₃	H
99	H	t-Bu	OCH ₃ CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	OCH ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	OCH_3 $C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	t-Bu	OCH ₃ OCF ₂ Br	H
	H	t-Bu	OCH ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	t-Bu	$0CH_3$ $0(L-45d)$	H
	H	t-Bu	OEt CF (CF ₃) ₂	H
	H	t-Bu	OEt C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	t-Bu	OEt C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	SCH ₃ CF (CF ₃) ₂	H
45	H	t-Bu	SCH ₃ C (CF ₃) 2 OH	H
	H	t-Bu	SCH ₃ C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	t-Bu	2-(CH ₂) ₄ -3-4-CF(CF ₃) ₂	11
	**	ı Du	2 (0112/4 0 4 01 (013/2	

	H	t-Bu		2-0CF ₂ 0-3-4-C1	
	H	t-Bu		2-0CF ₂ 0-3-4, 6-Cl ₂	
	4-F	t-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
_	4-C1	t-Bu	CH ₃		H
5	4-CF ₃		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	5-F	t-Bu	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	t-Bu	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	c-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	c-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	c-Bu	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	c-Bu	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	H	n-Pen	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ Pr-i	CH ₃		H
	H	CH2CH(CH3) Et	CH ₃		H
15	H	CH ₂ Bu-t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH(CH_3)Pr-n$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	$CH(CH_3)$ $Pr-n$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) Pr-n	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	$CH(CH_3)Pr-n$	CH ₃	0 (L-45d)	H
20	H	CH (CH ₃) Pr-i	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (Et) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₃	Н
25	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
30	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	H	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	4-F	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4-C1	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C(CH ₃) ₂ Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	6-F	C (CH ₃) ₂ Et	CH ₃	0 (L-45d)	H
	H	CH ₂ Hex-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	л Н
	H	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	H	CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	OCE CHEACE OF OF	H
	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF(CF ₃) ₂	H
45	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃		H
	H	CH ₂ CF ₃		C(CF ₃) ₂ OH	H
		-CH (CH ₃) CH ₂ F	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	11 (0)	011 (0113/ 01121	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н

			_		
	Н	(R) -CH (CH ₃) CH ₂ Br	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	(S) -CH (CH ₃) CH ₂ Br	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ C1	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ C1	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Br	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Br	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	Н	C (CH ₃) ₂ CHBrCH ₂ Br	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
10	H	CH ₂ OCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	
,	Н	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH ₂ CH ₂ OE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃		H
15	H	CH ₂ CH ₂ OPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH_2CH_2O (Ph-2-C1)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ O (Ph-3-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н Н
	H	CH ₂ CH ₂ O (Ph-4-C1)	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	
	H	CH ₂ CH (OH) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH ₂ CH (OH) Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH (OH) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH (OH) CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
	H	(R) -CH (CH ₃) CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
25	H	(S) -CH (CH ₃) CH ₂ OH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OEt	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₂ CH=CF ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) 20CH ₂ CF=CF ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	$C (CF_3)_2 OCH_2 CH = CC1_2$	H
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) 20CH ₂ Ph	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ C1) OH	H
35	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ C1) OCH ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	C (CF ₃) (CF ₂ CF ₃) OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	$C (CF_3) (CF_2 CF_3) OCH_3$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	3-C1
40	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	5-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃		3, 5-Cl ₂
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH3	OCF ₃	л, о ст ₂ Н
45	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	3-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₃	5-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	=	3-01 3, 5-01 ₂
			0113	501.3	υ, υ ⁻ υι ₂

				0.0T. D	11
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	•	OCF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	•	OCF ₂ Br	3-01
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	•	OCF ₂ Br	3-CH ₃
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH₃	OCF ₂ Br	5-C1
5	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	5-CH ₃
-	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	3, 5-Cl ₂
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHF 2	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHF 2	3-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHF 2	5-C1
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHF 2	3, 5-Cl ₂
10		-	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	6, 5 61 ₂
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃			3-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2CHFC1	5-Cl
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF 2 CHFC1	
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF 2 CHFC1	3, 5-Cl ₂
15	H	$CH (CH_3) CH_2 OCH_3$	CH ₃	OCF 2 CHFBr	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СН₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFCF ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	Н
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3, 5-Cl ₂
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
40	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	3-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	5-C1
			CH ₃	0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
0.0	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SF ₅	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃			H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SCF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	SCF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	S (0) CF ₃	
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	SO ₂ CF ₃	H
35	4-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	4-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СН₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	4-F	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	CH₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	4-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	4-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
40	4-C1	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	4-CF ₃	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	5-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	СНз	0 (L-45d)	H
	6-F	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	0-г Н	CH (CH ₃) CH ₂ OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
1 E		CH (CH ₃) CH ₂ OPr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OBu-i	-	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OF 10F 3/ 2	11

	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₂ CH ₂ SEt	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) CF ₃	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH3	C (CF ₃) 20CH ₃	Н
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH3	OCF 2 CHF 2	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF 2 CHFC 1	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
15	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH3	OCF 2 CHFOCF 3	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH3	0 (L-45d)	H
	4-F	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-C1	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	4-CF ₃	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	0 (L-45d)	H
	5-F	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
25	6-F	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHP $r-n$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHP $r-i$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHP $r-c$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH $_3$) CH $_2$ OC (O) NHBu-t	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CF ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHPh	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) N (CH ₃) $_2$	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) N (Et) $_2$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) N (Pr-i) $_2$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) N (CH ₃) Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	H	$CH (CH_3) CH_2 OC (0) (T-19)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) (T-22)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) (T -23)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$CH (CH_3) CH_2 OC (0) (T-24)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OP (0) (OEt) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
45	H	CH (CH ₃) CH ₂ OP (S) (OCH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OP (S) (OEt) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ OPh	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	Н

	Н	CH (CH ₃) CH ₂ O (Ph-4-C1)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ O (Ph-3-CF ₃)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (Et) CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (Et) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
5	H	CH (Ph) CH ₂ OH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
Ū	H	(R) -CH (Ph) CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH (Ph-2-C1) CH ₂ OH	. CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (Ph-4-C1) CH ₂ OH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (Ph-4-Ph) CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OH	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) 2 CH ₂ OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) 2CH ₂ OCH ₃	СНз	OCHF ₂	H
15	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	СНз	OCF ₂ CHF ₂	Н
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OCH_3$	СНз	OCF ₂ CHFC1	H
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СН₃	OCF ₂ CHFBr	H
20	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СН₃	OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СН₃	OCF ₂ CHFCF ₃	Н
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
25	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	0 (L-45d)	H
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	OSO ₂ CF ₃	H
	H	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	СНз	SF ₅	Н
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OCH_3$	CH ₃	SCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SCF ₂ Br	H
30	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH3	S (0) CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
	4-F		CH 3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	4-C		CH 3	0 (L-45d)	H
0.5	4-C		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
35	5-F		CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	6-F	· ·	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	н Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	СНз	OCF Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH₃	OCF ₂ Br	n H
<i>1</i> E	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH₃ CH₃	OCF CHFC1	п Н
45	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	СН _З	OCF ₂ CHFCl OCF ₂ CHFBr	n H
	H H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃ C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	п	0 (0113/ 2011200 (U) NITON3	0113	OOL SOLSDI	11

	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
5	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
Ů	4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4-C1	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
10	6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
	Н	C (CH ₃) 2CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) 2CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₃	H
15	H	C (CH ₃) 2CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH3	OCF ₂ CF ₂ Br	H
20	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH3	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (O) NHE t$	CH ₃	0 (L-45d)	H
25	4-F	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-C1	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4 –CF $_3$	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	0 (L-45d)	H
	6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHPr-n	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHPr-i	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHPr-c	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H H
0.5	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ S(-		H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OP (S) (OCH ₃) ₂	CH ³	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH (OEt) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ³		H
1 E	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OCH ₃ CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OEt	CH₃ CH₃	C (CF ₃) ₂ OH OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OPr-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OBu-i	•	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	on tong/ ongoing upu-1	CH ₃	O (OF 3/ 2UII	11

	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	T-10	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
5	Н	M-4a	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	M-5a	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ (M-16a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ (M-24a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
15	Н	CH ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	п Н
10	Н	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	H	CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃		H
	Н	CH ₂ CH ₂ SPr-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF(CF ₃) ₂	H
•	H	CH ₂ CH (CH ₃) SCH ₃	CH ₃		H
20	H	CH ₂ CH (CH ₃) SO ₂ CH ₃		C (CF ₃) ₂ OH	H
20	H	CH ₂ CH (CH ₃) SC ₂ CH ₃ CH ₂ CH (CH ₃) SEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH (CH ₃) SO ₂ Et	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃ CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CI	CF (CF ₃) ₂	H
20	H		СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	(R) -CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	n H	(S) -CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30		CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OEt	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH3	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CF ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
95	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₂ CF=CF ₂	H
35	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	$C (CF_3)_2 OCH_2 C \equiv CH$	H.
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	$C(CF_3)(CF_2C1)OH$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	$C(CF_3)(CF_2C1)OCH_3$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	$C(CF_3)(CF_2CF_3)OH$	H
40	Н.	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	$C(CF_3)(CF_2CF_3)OCH_3$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	OCF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHF 2	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
45	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H

PCT/JP02/07833

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

Н

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

H

Н

H

H

H

Н

H

158 OCF₂CFBrCF₃ CH₃ H CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ OCF 2 CHFOCF 3 H CH (CH₃) CH₂ SCH₃ OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 Br CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ H $OC (CF_2 CF_3) = C (CF_3)_2$ H CH (CH3) CH2 SCH3 CH₃ 5 CH₃ 0 (L-45d) CH (CH₃) CH₂ SCH₃ H CH₃ SF₅ H CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ SCF₃ H CF (CF₃)₂ Et CH (CH₃) CH₂ SCH₃ H CF (CF₃)₂ OCH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ H 10 CF (CF₃)₂ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ 4-F C (CF₃)₂OH CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ 4-F C (CF₃) 2 OCH₃ CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ 4-F OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ 4-F 0 (L-45d)CH₃ 4-F CH (CH₃) CH₂ SCH₃ 15 OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ 4-C1 0 (L-45d)CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ 4-CF₃ CF (CF₃)₂ 5-F CH (CH₃) CH₂ SCH₃ CH₃ C (CF₃)₂OH CH₃ CH (CH₃) CH₂ SCH₃ 6-F CF (CF₃)₂ CH₃ 20 H CH (CH₃) CH₂S (0) CH₃ $C(CF_3)_2OH$ CH (CH₃) CH₂S (0) CH₃ CH_3 H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH (CH₃) CH₂S (O) CH₃ CH₃ H 0 (L-45d)CH₃ H CH (CH₃) CH₂S (O) CH₃ CF (CF₃)₂ CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH3 H $C(CF_3)_2OH$ CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH3 25 H $C(CF_3)_2OCH_3$ CH₃ H CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH_3 OCF₂Br H OCF 2 CHFC 1 CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH_3

H OCF 2 CHFBr CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH 3 H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH (CH $_3$) CH $_2$ SO $_2$ CH $_3$ CH₃ H 30 0 (L-45d)CH3 H CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ SF₅ CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH₃ H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH₃ CH (CH₃) CH₂ SO₂ CH₃ 4-F 0 (L-45d)4-C1 CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH₃ CF (CF₃)₂ CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ CH₃ 35 4-CF₃

CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃

CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃

5-F

6-F

H CF (CF₃)₂ CH (CH₃) CH₂ SEt СHз H H C (CF₃) 2 OH CH (CH3) CH2 SEt CH₃ H C (CF₃)₂OH (S) -CH (CH₃) CH₂ SEt CH_3 40 H H $C(CF_3)_2OCH_3$ CH (CH₃) CH₂ SEt CH₃ H H OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH₃ CH (CH₃) CH₂SEt H H 0 (L-45d) CH (CH₃) CH₂SEt CH₃ H H CF (CF₃)₂ СНз H CH (CH₃) CH₂S (0) Et H $C(CF_3)_2OH$

CH₃

CH₃

 $C(CF_3)_2OH$

OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3

CH (CH₃) CH₂SO₂Et CH₃ H 45 OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 CH₃ CH (CH₃) CH₂ SPr-n H CH (CH₃) CH₂SPr-i CF (CF₃)₂ H CH_3

	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-n	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-i	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SBu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Bu-t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
5	H	CH (CH ₃) CH ₂ SHex-n	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
Ü	H	CH (CH ₃) CH ₂ SHex-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (0) CH ₂ CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	5-C1
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	5-01 H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ S (0) CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (0) CH ₂ CH ₂ OE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CH ₂ OC (0) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	л Н
20	H	$CH (CH_3) CH_2 SCH_2 C = CH$ $CH (CH_3) CH_2 SCH_2 C = CH$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (o) CH ₃ CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	л Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C (O) OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (0) NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (O) N (Et) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) NHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SC (S) N (CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
00	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (0) CH ₂ C (0) N (Et) ₂	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₂ C (O) N (Et) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₂ (Ph-2, 4-Cl ₂)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
•	H	CH (CH ₃) CH ₂ SPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	$CH (CH_3) CH_2 S (L-21a)$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH (CH_3) CH_2 SO_2 (L-21a)$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-35a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
40	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (0) (L-45a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ (L-45a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-48a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (D 48a) CH (CH ₃) CH ₂ S (O) (L-48a)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	п Н
45	H .		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	п Н
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (L-48b)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	п Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ S (D) (L-48b)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	п Н
	11	OH (OH3) OH25 (O) (L-40H)	0113	OUT 2UNTOUT 2UF 2UF 3	п

	ΤΤ	OH (CH) OH CO (T 40k)	Cn	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	$CH (CH_3) CH_2 SO_2 (L-48b)$	СН _з СН _з	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SSCH ₃	~		H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ SS (Ph-2-NO ₂)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (Et) CH ₂ SCH ₃	CH ³	CF (CF ₃) ₂	
5	H	CH (CH ₂ SCH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (Ph) CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH (Ph) CH ₂ S (0) CH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH (CH ₃) SCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH (CH ₃) SO ₂ CH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	H	CH (CH ₃) CH (CH ₃) SE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH (CH ₃) SO_2Et	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SCH_3$	Cl	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SCH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
15	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СН₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ 0Et	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СН₃	$C (CF_3)_2 OCH_2 CH = CF_2$	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СН₃	$C(CF_3)_2OCH_2CF=CF_2$	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ CH=CCl ₂	H
20	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OCH ₂ Ph	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) (CF ₂ C1) OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) (CF ₂ C1) OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) (CF ₂ CF ₃) OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) (CF ₂ CF ₃) OCH ₃	Н
25	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₃	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	OCF ₂ CHF ₂	H
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFC 1	Н
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFBr	H
30	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ Br	H
35	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
••	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	. CH ₃	SF ₅	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SCF ₃	Н
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SCF ₂ Br	H
40	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	S (0) CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	SO ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ OH	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
40	л Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	3-F
	л 4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	4r	0 (0113/ 2011230113	0113	O1 (OF 3/ 2	11

	·	0 /077 \ 077 -077		5 (OD) ATT	
	4-F	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	0 (L-45d)	H
5	4-C1	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	6-F		CH ₃	0 (L-45d)	H
		C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	_		
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) CH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
10	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) CH_3$	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	H (-)	$-C (CH_3)_2 CH_2 S (0) CH_3$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
		-C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	CH3	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	C (CH ₃) 2CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
			-		H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
15	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) CH_3$	СНз	0 (L-45d)	Н
	H	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 CH_3$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
0.0					
20	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	СНз	0 (L-45d)	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 CH_3$	СН₃	SF ₅	H
	4-F	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-C1	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
25	5-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	Н
40					
	6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH 3	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
30	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF ₂ Br	H
00	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
				-	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	СНз	OCF 2 CHFBr	
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CH₃	0 (L-45d)	H
35	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) Et$	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-n	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-n	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) Pr-n$	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 Pr-n$	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-i	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPr-i	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
			_		H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (0) Pr-i	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 Pr - i$	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SBu-t	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (0) Bu-t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SPh	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	11	o (ong/ gongorn	0113	201 ZOIH 001 ZOI ZOI 3	

	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ S (0) Ph	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SCH_2 (Ph-4-C1)$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	$C (CH_3) _2 CH_2 S (L-45a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	H	$C (CH_3)_2 CH_2 S (0) (L-45a)$	СНз	C (CF ₃) 2 OH	Н
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 (L-45a)$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
10	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	Н	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	Н
15	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ S (0) Et	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (Et) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	H	CH (CH ₂ OH) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	C (CH ₃) 2CH ₂ CH ₂ SEt	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ S (0) CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
25	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ SE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) ₃ S (0) Et	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ SO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	C (CH ₃) ₂ (CH ₂) ₃ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
30	H	C (CH ₃) ₂ (CH ₂) ₃ SE t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH (CH ₃) SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) 4SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	$CH (CH_3) (CH_2)_4 SO_2 CH_3$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (CH ₃) (CH ₂) 4 SE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	H	$CH(CH_3)(CH_2)_4S(0)Et$	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH(CH_3)(CH_2)_4SO_2Et$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CHO) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	C (CH ₃) (CHO) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	C (CH ₃) (CHO) CH ₂ SO ₂ Et	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
40	H	T-6	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	T-7	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	T-8 ·	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	T-9	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	T-11	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
45	H	T-12	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	T-13	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	T-14	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
				3, 2	

	H	T-15	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	M-8a	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	M-9a	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-9b	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
5	H	M-9c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
ŭ	H	M-19a	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ NHC (0) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ NHC (0) OE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ NHC (0) OPr-i	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	. Н
	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	H	CH ₂ CH ₂ NHC (0) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
10	H	CH ₂ CH ₂ NHPh	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	п Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂ CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂ CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂ CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	0 (L-45d)	H H
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (0) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (O) N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
25	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHC (S) NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	п Н
20	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ CH ₃ CH ₂ NHSO ₂ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	п Н
	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	H	CH (CH ₃) CH ₂ N (CH ₃) 30 ₂ CH ₃ CH (CH ₃) CH ₂ NHSO ₂ N (CH ₃) ₂	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
50	H	CH (CH ₃) CH ₂ NHP (S) (OCH ₃) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH(CH_3) CH_2NHP(S) (OEt)_2$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) Pr-c	CH ₃		H
UU	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) Bu-t$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF(CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) GF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
-	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) CH ₃	CH ₃		Н
	H	$C (CH_3) _2 CH_2 NHC (0) (L-1a)$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
40	H	$C (CH_3) _2 CH_2 NHC (0) (L-2a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	. H H
40	H	$C (CH_3) _2 CH_2 NHC (0) (L-3a)$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	H		-	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-4a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	л Н	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-16a)$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
46	п Н	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-17a)$	CH ³	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
45	H .	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-20a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	-	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-22a)$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) (L-23a)$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H



	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	H
5	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
J	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt	CH ₃	$C (CF_3)_2 OCH_3$	H
	H	~	_		H
	n H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OE t	CH3	OCF B	
		C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OE t	CH3	OCF CUE	H
1 🗆	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OE t	CH3	OCF CHF 2	H
15	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OE t	CH3	OCF_CHFC1	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt	CH3	OCF CE D	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt	CH3	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) 0Et	CH3	OCF 2 CHFCF 3	H
0.0	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) 0Et	CH3	OCF 2 CFBrCF 3	H
20	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) 0Et	СНз	0 (L-45d)	H
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	4-C1	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) 0Et	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
25	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	СНз	0 (L-45d)	H
	5-F	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OEt$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	6-F	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OPr-n$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	$CH_2CH_2CH_2NHC$ (0) OCH_3	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	H	$CH_2CH_2CH_2NHC$ (0) $OBu-t$	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-22a	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	M-22b	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	M-22c	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	M-22d	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	H	M-22e	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CHO	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C(CH ₃) ₂ CHO	CH₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	C (CH ₃) ₂ CHO	СНз	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	Н
	Н	C (CH ₃) ₂ CHO	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
40	H	C (CH ₃) ₂ CHO	СНз	0 (L-45d)	H
	H	CH (CH ₃) C (0) CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	Н	CH ₂ CH=NOCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Н	CH_2C (Ph) = $NOCH_3$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
45	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	Н
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
		120237 000 1100113	3	001 Z011 001 Z01 Z01 3	**

	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	СНз	0 (L-45d)	Н
	H	CH (CH ₃) CH=NOPr-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ Pr-c	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
Ü	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	_		H
	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ Ch=Ch ₂ CH (CH ₃) CH=NOCH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	n H	$CH(CH_3)C(CH_3) = NOCH_3$	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	H
1 0		C (CH ₃) ₂ CH=NOH	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	CH ₃	0 (L-45d)	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₃	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СН₃	OCF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH3	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFC1	H
20	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	H	C(CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
25	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4-F	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	4-C1	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	0 (L-45d)	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
30	5-F	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	6-F	C (CH ₃) 2 CH=NOCH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) 2 CH=NOE t	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 CH = NOCH_2 C (0) OBu - t$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₂ C (0) N (Et) ₂	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	H	C (CH ₃) (CH ₂ SO ₂ CH ₃) CH=NOH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) (CH ₂ SO ₂ Et) CH=NOH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	H	CH (CH ₃) CH ₂ CH=NOCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=NOEt	CH ₃		H
40	H	CH ₂ C (0) OE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	H	CH (CH ₃) C (0) OEt	-	C (CF ₃) ₂ OH	H
	n H	CH ₂ CH ₂ C (0) OEt	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
		<u> </u>	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (0) OEt	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
<i>1</i> C	H	CH (CH ₃) C (O) NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	H	CH (CH ₃) C (O) NHP _T -n	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) C (O) NHBu-n	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH (CH ₃) C (0) NHCH ₂ Ph	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H



PCT/JP02/07833 WO 03/011028 166

	Н	CH (CH ₃) C (0) N (CH ₃) ₂	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH (CH ₃) C (0) N (Et) 2	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (0) N (Pr-n) ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) C (0) (T-19)	CH3	CF (CF ₃) ₂	Н
5	H	CH (CH ₃) C (0) (T-20)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (0) (T-21)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
	H	CH (CH ₃) C (0) (T-22)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	
	H	CH (CH ₃) C (0) (T-23)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) C (0) (T-24)	CH ₃		H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (O) NHCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (0) NHE t	CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (0) N (CH ₃) ₂		C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) CH ₂ C (0) N (Et) ₂	CH 3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	$CH (CH_3) CH_2 C (0) N (CH_3) Ph$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	H		СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH (CH ₃) CN C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
		C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	C(CF ₃) ₂ OCH ₃	H
90	H.	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₃	H
20	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	СН₃	OCF ₂ CHFBr	H
۸۳	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
25	H	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₃	Н
	H	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	0 (L-45d)	H
30	4-F	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	0 (L-45d)	H
	4-C1	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ CN	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	5-F	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	6-F	C (CH ₃) ₂ CN	CH ₃	0 (L-45d)	H
35	Н	CH ₂ CH=CH ₂	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	$C (CH_3)_2 CH = CH_2$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH_2CH_2CH=CF_2$	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C(CH_3)_2CH=CHC(0)NHEt$	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C(CH_3)_2CH=CHPh(E)$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₃	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ Br	H
45	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHF ₂	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
		-	~ J	OI ZOIL DI	41

	Н	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
5	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	$CH_2C = CH$	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4-F	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	4-C1	CH ₂ C≡CH	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	4-CF 3		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	5-F	CH ₂ C≡CH	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	6-F	CH ₂ C≡CH	CH ₃		H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$		CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 C = CH$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 C = CH$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	H	$C (CH_3)_2 C = CH$	CH₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
10	H	$C (CH_3)_2 C = CH$	CH ₃	OCF 3	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	H	$C (CH_3)_2 C = CH$	CH3	OCF 2 CHF 2	H
	H		CH3	OCF 2 CHFC 1	H
20	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	OCF 2 CHFBr	Н
20	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	H
	n H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	H
	n H	$C(CH_3)_2C \equiv CH$	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	Н
		$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H
95	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
25	H 4 E	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	0 (L-45d)	H
	4-F	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	4-C1	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	4-CF ₃	C (CH ₃) ₂ C≡CH	CH₃	0 (L-45d)	H
0.0	5-F	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
30	6-F	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	C (CH ₃) ₂ C≡CPh	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-4-CH_3)$	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-4-CF_3)$	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
0.5	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-4-0CH_3)$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-4-OCF_3)$	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-2, 4-F_2)$	СН₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-2, 4-Cl_2)$	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (Ph-2, 6-Cl_2)$	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ C≡CNaph	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
40	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (L-3a)$	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (L-4a)$	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (L-45a)$	СН₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (L-45b)$	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 C \equiv C (L-46a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
45	H	CH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Н	CH ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
		-	3	2011 001 201 201 3	11

			100	•	
	H	CH ₂ Ph	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	H	CH_2 (Ph-2-F)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH_2 (Ph-2-F)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH_2 (Ph-2-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	H	CH ₂ (Ph-2-C1)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
Ū	Н	CH ₂ (Ph-2-C1)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	Н	CH_2 (Ph-2-C1)			
	H	CH_2 (Ph-3-CI)	CH3	0 (L-45d)	H
	H	-	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
1.0		CH ₂ (Ph-4-Cl)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	CH ₂ (Ph-2-CH ₃)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH ₂ (Ph-3-CH ₃)	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ (Ph-4-CH ₃)	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	CH ₂ (Ph-2-CF ₃)	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH_2 (Ph-2-0CH ₃)	СНз	$CF(CF_3)_2$	Н
15	H	CH_2 (Ph-3-OCH ₃)	СНз	C(CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH_2 (Ph-4-OCH ₃)	CH₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	H	CH_2 (Ph-4-OCF ₃)	CH₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	CH_2 (Ph-2, 3-Cl ₂)	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	CH_2 (Ph-2, 4-Cl ₂)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	CH_2 (Ph-3, 4-Cl ₂)	CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH_2 (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH_2 (L-46a)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH_2 (L-47a)	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH₃	CF (CF ₃) ₂	Н
25	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	(R) -CH (CH ₃) Ph	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	(S) -CH (CH ₃) Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	CH (CH ₃) Ph	CH ₃	0 (L-45d)	Н
30	H	CH (CH ₃) (Ph-2-C1)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	CH (CH ₃) (Ph-3-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH (CH ₃) (Ph-4-C1)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	$CH (CH_3) (L-1a)$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$CH (CH_3) (L-3a)$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
35	H	CH (CH ₃) (L-45a)	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
00	H	C (CH ₃) ₂ Ph	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$C (CH_3)_2 (Ph-3-C1)$	CH ₃		
	H	$C (CH_3)_2 (Ph-4-C1)$	_	CF (CF ₃) ₂	H
		CH ₂ CH ₂ Ph	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	H		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
40	H	CH ₂ CH ₂ (Ph-2-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH_2CH_2 (Ph-3-C1)	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	CH ₂ CH ₂ (Ph-4-C1)	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	CH ₂ CH ₂ (L-46a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ Ph	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	L-1a	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 169

	H H H	OPr−n OCH ₂ Ph NH ₂	CH ₃ CH ₃ CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF (CF ₃) ₂	H H H
	H	NHCHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	H	NHC (O) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	H	NHC (0) Ph	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	NHC (O) OCH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	NHC (0) OPh	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	NHC (0) OCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	N(CH ₃) ₂	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	H	N (CH ₃) CHO	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	$N (CH_3) C (O) CH_3$	CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	$N (CH_3) C (O) OCH_3$	CH₃	$C(CF_3)_2OH$	H

15 第2表

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 & Y^2 \\
R^1 & & 5 & Y^3 \\
R^2 & & 6 & 6 \\
\hline
C & 0 & R^2 \\
\hline
C & NH & 0 & R^3 \\
\hline
O & & & & & & \\
\hline
(2] - 7$$

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 & Y^2 \\
R^1 & 5 & 5 & 5
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
R^2 & C & R^3 & C & R^3 & C
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
CF_3 & C & NH & O & R^3 & C
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & 0 & 0 & 0
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
Y^{1} & \stackrel{3}{\longrightarrow} Y^{2} \\
R^{1} & \stackrel{|i|}{\longrightarrow} (Y^{3})_{n} \\
C & & & \\
R^{2} & & & \\
C & & \\
C & & \\
C & & \\
C & & \\
C & & & \\
C & &$$

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 & Y^2 \\
R^1 & 6 & 5 \\
\hline
 & C & 0 \\
\hline
 & C & N \\
\hline
 &$$

$$\begin{array}{c|c}
Y^{1} & 3 & Y^{2} \\
R^{1} & 6 & 5 & 5
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 6 & 6 & 6
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 0 & R^{2} & 6
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & N & Et & 0 & R^{3}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & 15 & 6 & 6
\end{array}$$

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 \\
R^1 & Y^2 \\
\hline
 & 1 \\$$

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & & & & \\
N & & & & \\
C & & \\
C & & \\
C & & \\
C & & & \\
C & &$$

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 & Y^2 \\
R^1 & & & \\
R^1 & & & \\
\hline
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & & \\
 & & &$$

$$Y^1$$
 X^2 Y^1 X^2 Y^2 Y^1 X^2 Y^2 Y^1 Y^2 Y^2 Y^3 Y^3 Y^2 Y^3 Y^3 Y^2 Y^3 $Y^$

	R¹	R ²	. R ³	Y 1	Y ²	(Y³) _n
5	CH ₃	СНз	CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	H	Et	Et	Н	$C(CF_3)_2OH$	· H
	Н	Et	Et	Н	3-0CF ₂ 0-4	
	Н	Et	Et	Н	3-0CHFCF ₂ 0-	-4
	H	Et	Et	H	3-0CF ₂ CHF0-	
10	H	Et	Et	H	3-0C (CF ₂ CF ₃	
	H	Et	Et	Н	3-0C (Ph-2-0	
	Н	Et	Et	Н	3-N=C (Ph-4-	·CF ₃) 0-4
	H	Et	Et	F	OCF 2 CHFOCF 2 CI	
	Н	Et	Et	C1	CF (CF ₃) ₂	H
15	H	Et	Et	Cl	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	Et	Et	Cl	OCF 2 CHFOCF 2 CI	F ₂ CF ₃ H
	H	Et	Et	Br	$C(CF_3)_2OH$	Ħ
	H	Et	Et	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Εt	Et	СН₃	$C(CF_3)_2OH$	H
20	H	Et	Εt	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	H	Εt	Et	СНз	OCHF ₂	H
	Н	Εt	Et	CH₃	OCHF ₂	3-C1
	Н	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	3-CH ₃
	Н	Et	Et	СНз	OCHF ₂	5-C1
25	Н	Et	Et	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₃	Ĥ
	Н	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ Br	Н
	Н	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHF 2	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFC1	H
30	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
	H	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ Br	Н
	Н	Et	Εt	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	Н
	Н	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃	H
	Н	Εt	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H

	TY	D.	E+	СП	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
	H	Et	Et	CH ₃ CH ₃	0 (L-45d) H	
	H	Et	Et			
	H	Et	Et	CH ₃	•	
_	H	Et	Et	CH ₃	SCF ₃ H	
5	H	Et	Et	Et	CF (CF ₃) ₂ H	
	H	Et	Et	Et	C (CF ₃) ₂ OH H	
	H	Et	Et	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	H	Et	Et	OCH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
	Н	Et	Et	OCH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	
10	H	Et	Et	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	CH ₃	Et	Et	СНз	$C (CF_3)_2 OH$	
	Et	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	CH ₂ OCH ₃	Et	Et	CH3	CF (CF ₃) ₂ H	
	CH ₂ OEt	Et	Et	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$ H	
15	CH ₂ SCH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
	CH ₂ SEt	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
	CH ₂ C (0) CH ₃	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H	
	CH2COOCH3	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
	CH ₂ COOEt	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
20	CH ₂ CN	Et	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H	
•	CH ₂ CH=CH ₂	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
	CH ₂ C≡CH	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
	C (0) CH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	C (0) Et	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d) H	
25	C (0) Ph	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
20	C (0) OCH ₃	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	C (0) OEt	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d) H	
	CN	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
	SCC1 ₃	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
30	SPh	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d) H	
00	SN (Et) 2	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
	SN (Pr-i) ₂	Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3 H	
	SN (Bu-n) ₂	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d) H	
	S (T-16)	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H	
יב	S (T-17)	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
35				CH ₃	0 (L-45d) H	
	S (T-18)	Et	Et	_	$CF(CF_3)_2$	
	S (T-23)	Et	Et	CH 3		
	SN (CH ₃) COOE t	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
4.0	SN (CH ₃) COOPr-n	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d) H	
40	SN (CH ₃) COOBu-n	Et	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂ H	
	SN (CH ₃) COOHex-n	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
	SN (Et) COOEt	Et	Et	СНз	0 (L-45d) H	
	SN (Et) COOPr-n	Et	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂ H	
	SN (Et) COOBu-n	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	
45	SN (Pr-i) COOEt	Et	Et	СН₃	0 (L-45d) H	
	SN (Pr-i) COOPr-n	Et	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂ H	
	SN (Pr-i) COOBu-n	Et	Et -	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H	

	S (0) 2CH3	Et	Et	СНз	0 (L-45d)	H
	S (0) ₂ Et	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	S (0) ₂ Ph	Et	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	NHC (0) CH ₃	Et	Et	CH ₃	0 (L-45d)	H
c	-	Et		Cl	CF (CF ₃) ₂	H
5	H		n-Pr			
	H	Et	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Et	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Н	Et_	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	H	n-Pr	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	Et ·	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	i-Pr	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H ·	C (0) CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
15	H	C (0) Et	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	C (0) Ph	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	C (0) OCH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	C (0) OEt	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H ·	SN (Bu-n) 2	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	H	SO ₂ CH ₃	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
20	H	NHC (0) CH ₃	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
		H	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₃				OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₃	CH ₃	i-Pr	CH ₃		H
0.5	Et	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
25	Et	CH ₃	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	CH ₂ OCH ₃	H	i-Pr	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ OEt	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	Н	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SEt	H	i–Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	$\mathrm{CH_{2}C}$ (0) $\mathrm{CH_{3}}$	Н	i-Pr	СНз	$CF(CF_3)_2$	H
	CH ₂ COOCH ₃	H	i-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	CH ₂ COOEt	H	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CN	H	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CH ₂	H	i-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
35	CH ₂ C≡CH	H	i-Pr	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	CH ₃	Н	t-Bu	H	CF (CF ₃) ₂	H
	H	CH ₂ CH ₂ OEt	CH2CH2OEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	H	Et	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40			CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
	H	Et		-		
	H	Et	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	H	n-Pr	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H		CH ₂ CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	H		H ₂ CH ₂ S (0) ₂ CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
	H		H (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	H	Εt	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

176

	H H H		CH ₂ CH ₂ CH ₂ S (0) CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF (CF ₃) ₂ C (CF ₃) ₂ OH	H H H
_	CH ₃	СН₃	CH ₂ Ph	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
5	H	Et	CH_2Ph	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
	CH₃	H	CH (CH ₃) Ph	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Н	$-CH_2CH_2$	₂ CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	H	-CH ₂ OCI	H ₂ CH ₂ -	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	Н	-CH ₂ SCI	H ₂ CH ₂ -	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	H	$-CH_2CH_2$	2CH2CH2CH2-	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H	$-CH_2CH_2$	₂ CH (CH ₃) CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	H	-CH ₂ CH (CI	H ₃) CH ₂ CH (CH ₃) CH ₂ -	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	H
	H	$-CH_2CH_2$	2OCH2CH2-	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	H .	-CH ₂ CH	(CH ₃) OCH (CH ₃) CH ₂ -	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	Н	_	2 CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H

第3表

$$Y^{1}$$
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{4}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{2}

$$Y^{1}$$
 X^{2}
 Y^{2}
 Y^{1}
 Y^{2}
 Y^{3}
 Y^{3

(R ⁴) _p	Y 1	Y 2	(Y ³) n
4-CH ₃ (R)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
4-CH ₃ (R)	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
4-CH ₃ (R)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
4-CH ₃ (R)	CH ₃	0 (L-45d)	H
4-CH ₃ (S)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
4-CH ₃ (S)	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
4-CH ₃ (S)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
4-CH ₃ (S)	CH ₃	0 (L-45d)	H
4-Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5-Ph	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
4- (Ph-4-Bu-t)	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
$4, 4-(CH_3)_2$	H	3-CF ₂ 0CF ₂ 0-4	
$4, 4-(CH_3)_2$	C1	CF (CF ₃) ₂	H
$4, 4-(CH_3)_2$	Cl	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H

```
4, 4-(CH_3)_2
                                                                                c_1
                                                                                                    3-CF<sub>2</sub>OCF<sub>2</sub>0-4
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                Br
                                                                                                CF (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                Br
                                                                                                CF<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                                                               H
                                                                                CH3
                                                                                                CF2CF3
  5
                                                                                                                                               H
                  4, 4- (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                CF (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                                                                                                CF (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH3
                                                                                                                                                3-F
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                CF2CF2CF2CF3
                                                                                                                                                H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                C (CF<sub>3</sub>) 20H
                                                                                                                                               H
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                C (CF<sub>3</sub>) 20CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                                H
10
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                СНз
                                                                                                OCHF<sub>2</sub>
                                                                                                                                               H
                                                                                                                                               3-C1
                                                                                                OCHF 2
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               3-CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCHF<sub>2</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                                                               5-C1
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCHF<sub>2</sub>
                                                                                                                                               5-CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
15
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCHF 2
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCHF<sub>2</sub>
                                                                                                                                               3, 5-Cl<sub>2</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                                                               H
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                                                                                                                                               3-C1
                                                                                CH<sub>3</sub>
20
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                                                                                                                                               3-CH<sub>3</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                                                                                                                                               5-C1
                  4, 4-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               5-CH_3
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                                                                                                                                               3, 5-Cl<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                  4, 4- (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF 2 CHF 2
                                                                                                                                               H
                  4, 4- (CH<sub>3</sub>) 2
                                                                                                OCF 2 CHFC 1
                                                                                                                                               H
25
                                                                                CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                OCF 2 CHFBr
                                                                                                                                               H
                                                                                CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                СНз
                                                                                                OCF 2 CF 2 Br
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                                OCF 2 CHFCF 3
                                                                                                                                               H
                                                                                CH<sub>3</sub>
                  4, 4-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF 2 CFBrCF 3
                                                                                                                                               H
30
                                                                                                OCF 2 CHFOCF 3
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3
                                                                                                                                                H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                СНз
                                                                                                OSO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                0 (L-45d)
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                SF<sub>5</sub>
35
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                CH<sub>3</sub>
                                                                                                SCF<sub>2</sub>Br
                                                                                                                                               H
                                                                                                CF (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                                                                               H
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                Εt
                                                                                                C (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH
                                                                                                                                                Н
                  4, 4-(CH_3)_2
                                                                                OCH<sub>3</sub>
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                                CF2CF3
                                                                                                                                                H
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                                                                                                CF (CF<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
                                                                                                                                                H
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                 CH3
40
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                                                                                                C(CF_3)_2OH
                                                                                                                                                H
                                                                                                                                                H
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                                                                                                C(CF_3)_2OCH_3
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                                                                                H
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF<sub>3</sub>
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                                                                               H
                                                                                                OCF<sub>2</sub>Br
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF 2 CHF 2
                                                                                                                                                Н
                                                                                 CH<sub>3</sub>
45
                  4-CH3-4-CH2SCH3
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF CHFC1
                                                                                                                                               H
                  4-CH<sub>3</sub>-4-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>
                                                                                                OCF , CHFBr
                                                                                                                                               H
                                                                                 CH<sub>3</sub>
                  4-CH3-4-CH2SCH3
                                                                                                OCF 2 CF 2 Br
                                                                                                                                                H
                                                                                 CH<sub>3</sub>
```

WO 03/011028		PCT/JP02/07833
	183	

	$4-CH_3-4-CH_2SCH_3$	СНз	OCF ₂ CHFCF ₃	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	СНз	OCF ₂ CFBrCF ₃	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H	
5	4-CH ₃ -4-CH ₂ SCH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H	
Ū	4-CH ₃ -4-CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H	
	$4-CH_3-4-CH_2S$ (0) CH_3	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₃	H	
	$4-CH_3-4-CH_2S$ (0) CH_3	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H	
10	$4-CH_3-4-CH_2S$ (0) CH_3	CH ₃	0 (L-45d)	Н	
10	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H	
15	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H	
10	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SEt	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H	
	$4-CH_3-4-CH_2SEt$ $4-CH_3-4-CH_2S(0)$ Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H	
20	$4-CH_3-4-CH_2S$ (0) Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H	
20	-	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ S (0) Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ Et	-		H	
	4-CH ₃ -4-CH ₂ SO ₂ Et	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	n H	
	$4-CH_3-4-CH_2SO_2Et$	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	П	
25					

第4表

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 & Y^2 \\
H & 5 & 5 \\
C & 6 & (Y^3)_n
\end{array}$$

$$\begin{array}{c|c}
C & K & K & K & K \\
C & K & K & K & K \\
R^5 & K & K & K & K & K \\
\hline
[4] - 3
\end{array}$$

[4] - 5

[4] - 38

または

[4] - 37

R ⁵	R ⁶	Y 1	Y ²	(Y³) n
Et	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
Et	Et	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
Et	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
Et	Et	CH ₃	0 (L-45d)	Н
n-Pr	Et	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
i-Pr	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
c-Pr	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
c-Pr	E t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
n-Bu	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	Et	-	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
i-Bu		CH ₃		H
s-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	
n-Pen	H	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
c-Pen	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
c-Pen	Н	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
n-Hex	Н	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
c-Hex	H .	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
CH_2CF_3	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ CF ₃	Н	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
CH ₂ CF ₃	Н	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
CH ₂ CF ₃	Н	CH ₃	0 (L-45d)	H
CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
CH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
	СНО	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ CF ₃		CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₂ CF ₃	C (0) CH ₃	-		
CH ₂ CF ₃	C (0) Et	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
CH ₂ CF ₃	C(0) CF ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ CF ₃	C (0) OCH 3	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₂ CF ₃	C (0) 0E t	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
CH ₂ OCH ₃	СНО	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ OCH ₃	C (0) CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
CH ₂ OCH ₃	C (0) E t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
CH ₂ OCH ₃	C (0) CF ₃	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
CH ₂ OCH ₃	C (0) OCH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
CH ₂ OEt	СНО	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
CH ₂ OEt	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ OEt	C (0) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₂ OEt	C (0) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
_		CH₃ CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ OEt	C (0) 0E t			
CH ₂ SCH ₃	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
CH ₂ SCH ₃	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
CH ₂ SCH ₃	Н	CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	Н

	CH ₂ SCH ₃	ΤΤ	CII	OCITE	TT
	_ -	H	CH ³	OCHF ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCHF ₂	3-C1
	CH ₂ SCH ₃	H	CH3	OCHF ₂	3-СН з
-	CH ₂ SCH ₃	H	СНз	OCHF ₂	5-C1
5	CH ₂ SCH ₃	Н	СНз	OCHF ₂	5-CH ₃
	CH ₂ SCH ₃	Ή.	CH ₃	OCF ₃	Н
	CH ₂ SCH ₃	H	СНз	OCF ₂ Br	H
	CH ₂ SCH ₃	Н	CH₃	OCF ₂ CHFC1	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
10	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	H
	CH ₂ SCH ₃	Н	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SCH ₃	H	CH ₃	0 (L-45d)	Н
	CH ₂ SCH ₃	СНО	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	Н
15	CH ₂ SCH ₃	C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	CH ₂ SCH ₃	C (0) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SCH ₃	C (0) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SE t	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	CH ₂ SEt	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
20	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	-	3-C1
	CH ₂ SEt	H	_	OCHF ₂	3-CH ₃
25			CH 3	OCHF ₂	5-C1
20	CH ₂ SEt CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCHF ₂	5-CH ₃
		H	CH 3	OCF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ Br	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF 2 CHFC 1	H
20	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFBr	H
30	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	CH ₂ SEt	H	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	H
	CH ₂ SEt	H	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ SEt	Н	CH ₃		H
	CH ₂ SEt	СНО	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	CH ₂ SEt	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SEt	C (0) CF ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ SEt	C (0) OCH ₃	CH₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	CH ₂ SPh	H	CH ₃	C (CF ₃) 2 OCH ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃		Н
	CH ₂ SPh	Н	CH ₃		H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃		H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
45	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃	H
	CH ₂ SPh	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	CH ₂ SPh	H	_		
	OH 5 91 H	11	CH ₃	0 (L-45d)	Н

	CH ₂ SPh	СНО	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	CH ₂ SPh	C (0) CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	CH ₂ SPh	C (0) CF ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	CH ₂ SPh	C (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
5	CH ₂ CN	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
J	CH ₂ CN	СНО	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	CH ₂ CN	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CN	C (0) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CN	C (0) OCH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
10	CH ₂ C (0) OCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	CH ₂ C (0) OCH ₃	СНО	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (0) OCH ₃	C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C (0) OCH ₃	C (0) CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	CH ₂ C (0) OCH ₃	C (0) OCH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
15	CH ₂ C (0) NHCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
19	CH ₂ C (0) NHCH ₃	СНО	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
		C (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C (0) NHCH ₃	C (0) CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	CH ₂ C (O) NHCH ₃	C (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
0.0	CH ₂ C (0) NHCH ₃	_	CH ₃		Н
20	CH_2C (0) N (CH_3) ₂	Н		C (CF ₃) ₂ OH	Н
	CH_2C (0) N (CH_3) 2	CHO CH	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH_2C (0) N (CH_3) 2	C (0) CH ₃	CH 3	CF (CF ₃) ₂ C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH_2C (0) N (CH_3) 2	C (0) CF ₃	CH 3		Н
0.5	CH ₂ C (0) N (CH ₃) ₂	C (0) OCH ₃	CH 3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF (CF ₃) ₂	Н
25	CH ₂ CH=CH ₂	H CHO	CH₃ CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ CH=CH ₂		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	CH ₂ CH=CH ₂	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	CH ₂ CH=CH ₂	C (0) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
0.0	CH ₂ CH=CH ₂	C (0) OCH ₃	-	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
30	CH ₂ CH=CCl ₂	H CHO	CH₃ CH₃		H
	CH ₂ CH=CCl ₂		-	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	C (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ CH=CCl ₂	C (0) CF ₃	CH₃ CH₃	CF (CF ₃) ₂	Н
0.5	CH ₂ CH=CCl ₂	C (0) OCH ₃			H
35	$CH_2C \equiv CH$		CH3	C (CF ₃) 2 OH	
	CH ₂ C≡CH	CHO	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	$CH_2C \equiv CH$	C (0) CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CH	C (0) CF ₃	CH3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C≡CH	C (0) OCH ³	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
40	CH ₂ C≡CCl	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CCl	CHO	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ C≡CCl	C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ C≡CCl	C (0) CF ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ C≡CC1	C (0) OCH ³	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	CH ₂ Ph	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ Ph	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ Ph	СНО	CH3	CF (CF ₃) ₂	H

	CH ₂ Ph	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	CH ₂ Ph	C (0) CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CH ₂ Ph	C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ Ph	C (0) CH ₃	CH ₃	0 (L-45d)	H
5	CH ₂ Ph	C (0) CF ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
ี่		C (0) OCH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	CH ₂ Ph	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
•	CH ₂ (L-1a)	n-Bu	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	CHO	i-Bu	-	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	СНО		CH 3		H
10	CHO	s-Bu	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ C (CF ₃) ₂ OH	H
	CHO CH	c-Pen	CH ₃ CH ₃		H
	C (0) CH ³	n-Bu	-	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₃	n-Bu	CH ³	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
1.5	C (0) CH ₃	c-Pen	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (0) CH ₃	c-Pen c-Pen	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
	C (0) CH ₃		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₃	c-Pen	CH ₃	0 (L-45d)	п Н
	C (0) CH ₃	C (0) CH ₃	CH ³	CF (CF ₃) ₂	n H
00	C (0) Et	n-Pr	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	
20	C (0) Et	i-Pr	CH 3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	C (0) Et	n-Bu	CH ³	CF (CF ₃) ₂	H H
	C (0) Pr-n	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (0) Pr-i	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H H
0.5	C (0) Pr-c	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	п Н
25	C (0) Bu-n	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (0) Bu-n	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	Н
	C (0) Bu-n	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
	C (0) Bu-n	i-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
0.0	C (0) Bu-i	H	CH 3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H H
30	C (0) Bu-i	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
	C (0) Bu-i	Et D-	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (0) Bu-i	n-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H H
	C (0) Bu-s	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
0.5	C (0) Bu-s	CH ₃	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	n H
35	C (0) Bu-s	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	C (0) Bu-s	i-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H H
	C (0) Bu-c	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (0) Bu-c	CH ₃	CH 3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
10	C (0) Bu-c	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
40	C (0) Bu-c	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	$C (0) CH_2 Pr-c$	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C (0) CH_2 Pr-c$	CH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) CH_2 Pr-c$	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) Pen-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	C (0) Pen-n	CH ₃	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) Pen-c	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) Pen-c	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

	C (0) Pen-c	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	C (0) Hex-n	H	CH ₃		Н
			_	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (0) Hex-n	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
_	C (0) Hex-c	-H	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
5	C (0) Hex-c	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) Hex-c	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₂ Pen-c	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₂ Pen-c	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH ₂ F	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
10	C (0) CH ₂ F	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₂ F	Et	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH ₂ F	i-Pr	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₂ C1	Н	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₂ Cl	СНз	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
15	C (O) CH ₂ C1	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₂ Cl	n-Pr	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CHF $_2$	Н	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) CHF ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	C (0) CHF ₂	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
20	C (0) CHF ₂	Et	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) CHF $_2$	Et	CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	C (0) CHF ₂	Et	СНз	OCF ₃	H
	C (0) CHF ₂	Et	СНз	OCF ₂ Br	H
	C (0) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	H
25	C (0) CHF ₂	Et	СНз	OCF ₂ CHFBr	H
	C (0) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFCF ₃	H
	C (0) CHF ₂	Et	СНз	OCF 2 CHFOCF 3	H
	C (0) CHF ₂	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) CHF ₂	Et	CH ₃	OSO ₂ CF ₃	H
30	C (0) CHF ₂	Et	CH ₃	0 (L-45d)	H
	C (0) CHF ₂	Et	Et	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CHF ₂	Et	OCH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) CHF ₂	i-Pr	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) CHC I ₂	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	C (O) CHCl ₂	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CHC1 ₂	Et	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CHCl ₂	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CCl ₃	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CCl ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
40	C (0) CCl ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
10	C (0) CF ₂ Br	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CF ₂ Br	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
	C (0) CF ₂ Br	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	C (0) CF ₂ Br	Et	CH ₃	$C (CF_3)_2 OH$	H
45		Et	CH ₃	-	H
40	C (0) CF ₂ Br		_	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CF ₂ Br	Et i_Dr	CH3	0 (L-45d)	
	$C (0) CF_2Br$	i–Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H

	C (0) CH ₂ CH ₂ Cl	СНз	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH ₂ CH ₂ C1	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CHC1CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CHC1CH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	C (0) CH ₂ CH ₂ Br	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
•	C (O) CH ₂ CH ₂ Br	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₂ CF ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₂ CF ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (O) CH ₂ CF ₃	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CF ₂ CHF ₂	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CF ₂ CHF ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CF ₂ CHF ₂	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CF ₂ CHF ₂	i-Pr	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	C (0) C ₂ F ₅	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) C ₂ F ₅	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) C ₂ F ₅	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) C ₂ F ₅	n-Pr	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CF ₂ CF ₂ C1	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
20	C (0) CF ₂ CF ₂ C1	CH ₃	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) CF ₂ CF ₂ C1	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) C (CH ₃) ₂ CH ₂ C1	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
25	C (O) CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CF ₂ Br	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) C_3 F_7$	Н	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	$C(0)C_3F_7$	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C(0) C_3 F_7$	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	C (0) CH_2CH (CH_3) CF_3	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) CH_2CH (CF_3) ₂	CH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (O) (T-1)	CH ₃	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (T-4)	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	C (0) CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	0 (L-45d)	H
40	C (O) CH ₂ OCH ₃	i-Pr	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) CH ₂ OEt	Н	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
•	C (0) CH ₂ OEt	CH ₃	CH ₃	$CF(CF_3)_2$	H
	C (0) CH ₂ OE t	Et	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH (CH ₃) OCH ₃	СНз	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
45	C (0) CH ₂ OCH ₂ CF ₃	СНз	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) CH_2 OCH_2 CH_2 OEt$	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C(0) CH2OC(0) CH3	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

	C (O) CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	C (O) CH ₂ SCH ₃	Н	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ SCH ₃	СНз	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂	
	C (O) CH ₂ SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	
5	C (O) CH ₂ SCH ₃	n-Pr	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	CH ₃		Н ао ао
	C (0) CH2SO2CH3	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2	_
	C (O) CH ₂ SO ₂ CH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ SEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
10	C (0) CH ₂ SEt	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ C	_
	C (O) CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH ₂ CN	H H	-	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 C	
	C (O) CH ₂ CN	Et	CH ³	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (O) CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	C (0) CH ₂ C (0) OEt	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 C	
	C (0) CH=CH ₂	CH ₃	CH 3	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH=CH ₂	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	C (O) CH=CHCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CI	
20	C (0) CH=CHCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) C (CH_3) = CH_2$	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) CH=CHCH ₂ C1	CH ₃	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	CH ₃	CH 3	OCF 2 CHFOCF 2 CI	
	C (0) C≡CH	H	CH ³	CF (CF ₃) ₂	H
25	C (0) C≡CH	CH ₃	СН _з СН _з	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C(0) C = CH	Et		OCF 2 CHFOCF 2 CF	
	$C (0) CH_2 C \equiv CH$	CH ₃	CH ³	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) CH_2C \equiv CCH_3$	CH ₃	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) C≡CC1	CH ₃	CH₃	OCF 2 CHFOCF 2 CH	
30	$C (0) CH_2C \equiv CC1$	CH ₃	CH₃ CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) CH_2 (M-9c)$	CH ₃		C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) CH ₂ Ph	CH ₃	СН _з СН _з	OCF 2 CHFOCF 2 CF	
	C (0) CH ₂ Ph	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) CH ₂ (L-14a)	CH ₃	-	C (CF ₃) ₂ OH	H
35	$C (0) CH_2 (L-24a)$	CH ₃	СП СН ^З	OCF 2 CHFOCF 2 CF	
	$C (0) CH_2 (L-36a)$	CH ₃	CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) CH_2 (L-45a)$	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	$C (0) CH_2 (L-46a)$	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF	
	$C (0) CH_2 (L-47a)$	CH ₃	CH₃	CF (CF ₃) ₂	Н
40	C (0) C (0) OCH ₃	Н	CH 3	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) C (0) OCH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) C (0) OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2	
	C (0) C (0) OCH ₃		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) C (0) OCH ₃	Et Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
45	C (0) C (0) OCH ₃		CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) C (0) OEt	n-Pr u	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2	
	C (0) C (0) OEt	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) C (O) UE (CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H

	C (0) C (0) OB+	ъ.		OD (OD :	
	C (0) C (0) OEt	Et	СН₃	$CF(CF_3)_2$	H
	C (0) C (0) OE t	Et	СН₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF	3 H
	C (0) (M-4a)	СНз	CH₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	C(0)(M-5a)	СНз	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
5	C(0) (M-8a)	СНз	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF	
	C (0) 0Pr-n	CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	, л Н
	C (0) OPr-n	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) OPr-i	CH3	CH ₃		
	C (0) OPr-i	Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
10	C (0) OPr-c	CH ₃		CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) OPr-c	Et	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) OBu-n		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	•	CH₃	CH₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) OBu-s	CH₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
1 -	C (0) OBu-i	H	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (0) 0Bu-t	СНз	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) OPen-n	СНз	СНз	CF (CF ₃) ₂	Н
	C (O) OCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) OCH ₂ CF ₃	Εt	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
	C (O) OCH ₂ CCl ₃	H	. CH3	CF (CF ₃) ₂	H
20	C (O) OCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	СНз	CH₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ Cl	CH3	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF	
	C (O) OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	3 II H
	C (0) OCH ₂ CH ₂ OEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (O) OCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
25	C (0) OCH ₂ CH=CHCH ₃	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	Н
	$C (0) OCH_2C (CH_3) = CH_2$	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
	C (0) OCH (CH ₃) CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	$C (0) OCH_2 CH=C (CH_3)_2$	CH ₃	CH ₃		
	C (0) OCH2C (CH3) = CHCH3	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
30	C (0) OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃		C (CF ₃) ₂ OH	H
•	C (0) OCH_2CH (CH_3) $CH=CH_2$	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	$C (0) OCH_2 CH_2 C (CH_3) = CH_2$	-	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) OCH_2CC1=CH_2$	CH ₃	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
		CH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
35	$C (0) OCH_2 CH = CHBr$	CH3	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
00	$C(0) OCH_2CC1=CC1_2$	CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) OCH ₂ CH=CC1CH ₃	CH3	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C (0) OCH_2C (CH_3) = CHBr$	СНз	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) OCH ₂ CH=CHCF ₃	СНз	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (O) OCH ₂ CH=CHCF ₂ Br	СНз	CH₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
40	$C(0) OCH_2CH=CCICF_3$	СНз	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) OCH_2CH_2CBr=CH_2$	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) OCH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C (0) OCH_2C \equiv CCH_3$	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) OCH_2C = CEt$	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
45	C (0) OCH (CH ₃) C \equiv CH	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) OCH (CH ₃) $C \equiv CCH_3$	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H·
	$C(0) OCH_2 CH_2 C \equiv CH$	CH ₃	CH ₃		
	(1, 1112 on 2 o - on	0113	υng	C (CF ₃) ₂ OH	Н

	$C (0) OCH2CH2C \equiv CCH3$	СНз	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C(0) O(M-5a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H
	C(0) O(M-9a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	C(0) O(M-9c)	CH ₃	CH ₃	
5	C (0) OCH ₂ Ph	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C (0) OPh	CH ₃		CF (CF ₃) ₂ H
	C (0) OPh	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	C (0) SCH ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C (0) SCH ₃		CH₃	CF (CF ₃) ₂ H
10	C (0) SCH ₃	CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$
10	C (0) SCH ₃	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂ H
		Et	СНз	$C(CF_3)_2OH$
	C (0) SCH ₃	Et	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$ H
	C (0) SCH ₃	Et	СН₃	OCF ₃ H
15	C (0) SCH ₃	Et	СН₃	OCF ₂ Br H
15	C (0) SCH ₃	Et	СН₃	OCF ₂ CHFC1 H
	C (O) SCH ₃	Εt	СНз	OCF ₂ CHFB _r H
	C (O) SCH ₃	Εt	СНз	OCF ₂ CHFCF ₃ H
	C (0) SCH ₃	Εt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₃ H
	C (O) SCH ₃	Εt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
20	C (O) SCH ₃	Εt	CH ₃	0 (L-45d) H
	C (O) SCH ₃	Et	Et	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C (0) SCH ₃	Et	ОСНз	CF (CF ₃) ₂ H
	C (0) SE t	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	C (0) SE t	CH ₃	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
25	C (0) SE t	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H
	C (0) SE t	Et	CH ₃	-
	C (0) SE t	Et	CH ₃	- / · · ·
	C (0) SE t	Et	CH ₃	
	C (0) SE t	Et	CH ₃	
30	C (0) SE t	Et		OCF CUPCI
	C (0) SE t	Et	CH ₃	OCF CHFC1 H
	C (0) SE t	Et	CH ₃	OCF CHFBr H
	C (0) SE t		CH3	OCF ₂ CHFCF ₃ H
	C (0) SE t	Et	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₃ H
35	C (0) SE t	Et	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
00	C (0) SPr-n	Et	СН₃	O (L-45d) H
		CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂ H
	C(0) SPr-n	Et	СН₃	$C (CF_3)_2 OH$ H
	C (0) SCH ₂ CF ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
40	C (0) SCH ₂ CF ₃	Et	CH₃	CF (CF ₃) ₂ H
40	C (0) SCH ₂ CH=CH ₂	СНз	CH₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	$C(0) SCH_2C(CH_3) = CH_2$	СНз	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C(0) S(M-9c)	СНз	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H
	C (0) SPh	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	C (0) SPh	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H
45	$C(0) N(CH_3)_2$	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ H
	C (0) N (CH ₃) 2	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ H
	C (0) N (CH ₃) OCH ₃	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH H
	03	 3	OH 3	C (Gr 3/ 2Un n

	C (O) N (CH ₃) OCH ₃	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C(0) (Ph-2-F)	СНз	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-3-F)	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) (Ph-4-F)	CH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
5	C (0) (Ph-2-C1)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
-	C (0) (Ph-2-C1)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-3-C1)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) (Ph-3-C1)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-4-C1)	CH ₃	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
10	C (0) (Ph-4-C1)	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-2-Br)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (O) (Ph-3-Br)	CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) (Ph-4-Br)	CH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C(0) (Ph-2-I)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
15	C (0) (Ph-3-I)	CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) (Ph-4-I)	CH ₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C (0) (Ph-2-CH_3)$	СНз	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) (Ph-3-CH_3)$	СНз	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	$C (0) (Ph-4-CH_3)$	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
20	C (0) (Ph-2-Et)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-3-Et)	CH ₃	CH ₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) (Ph-4-Et)	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	$C(0) (Ph-2-CF_3)$	CH ₃	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) (Ph-3-CF_3)$	CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OH$	H
25	$C(0) (Ph-4-CF_3)$	СНз	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	$C (0) (Ph-2-0CH_3)$	СНз	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	$C (0) (Ph-3-0CH_3)$	СН₃	СН₃	$C (CF_3)_2OH$	H
	$C(0) (Ph-4-0CH_3)$	СНз	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) (Ph-2-0CHF ₂)	СН₃	СН₃	$CF(CF_3)_2$	H
30	C (0) $(Ph-3-OCHF_2)$	СНз	СН з	$C(CF_3)_2OH$	H
	C (0) (Ph-4-0CHF $_2$)	СНз	СН₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) (Ph-2-OCF ₃)	СНз	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-3-0CF ₃)	СН₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	$C(0) (Ph-4-0CF_3)$	СН₃	- СН з	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
35	$C(0) (Ph-2-SCH_3)$	СН₃	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$C(0) (Ph-3-SCH_3)$	СНз	СН₃	$C(CF_3)_2OH$	Н
	C(0) (Ph-4-SCH ₃)	СН₃	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C(0) (Ph-2-SO_2CH_3)$	СН₃	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C(0) (Ph-3-S02CH3)	СНз	СН₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
40	$C(0) (Ph-4-S0_2CH_3)$	СН₃	СН₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	C(0) (Ph-2-SCHF ₂)	CH ₃	СН₃	$CF(CF_3)_2$	H
	C(0) (Ph-3-SCHF ₂)	CH3	CH₃	$C(CF_3)_2OH$	H
	C(0) (Ph-4-SCHF ₂)	СНз	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C(0) (Ph-2-SCF ₃)	CH ₃	СНз	$CF(CF_3)_2$	H
45	$C(0) (Ph-3-SCF_3)$	CH ₃	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C(0) (Ph-4-SCF ₃)	СНз	сн з	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$C (0) (Ph-2-NO_2)$	CH ₃	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H

	C (0) (Ph-3-NO ₂)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	Н
	C (0) (Ph-4-NO ₂)	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	C (0) (Ph-2-CN)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (Ph-3-CN)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
5	C (0) (Ph-4-CN)	CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
Ū	C (0) (L-1a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	C (0) (L-2a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) (L-3a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) (L-4a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (0) (L-16a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
10	C (0) (L-17a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (0) (L-20a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
		CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) (L-23a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
15	C (0) (L-45a)	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
10	C (0) (L-46a)	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
	C (0) (L-47a)	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	C (S) OPr-i		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
		CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	H
90	C (S) OPr-i	Et	-		H
20	C (S) OPen-n	CH ₃	CH ³	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF (CF ₃) ₂	H
	C (S) OPh	CH ₃	CH ₃		H
	C (S) SCH ₃	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	n H
	C (S) SCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	n H
0.5	C (S) SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
25	C (S) SEt	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
	C (S) SEt	Et	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H H
	C (S) SCH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	n H
	$C (S) SCH_2C (CH_3) = CH_2$	CH ₃	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	
0.0	C (S) SPh	CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
30	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	-C (0) C (CH ₃) ₂ CH ₂ -		Br	C (CF ₃) ₂ OH	H
	-C (0) C (CH ₃) ₂ CH ₂ -		CH3	CF (CF ₃) ₂	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
35	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	_	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	H
	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH	_	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	
	OH	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	ОН	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	OC (0) CH ₃	C (0) CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
40	SO ₂ CH ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SO ₂ CH ₃	Et	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH3	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	SO ₂ CF ₃	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	Н
45	SO ₂ CF ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCC13	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SCC1 ₃	H	CH ₃	$C (CF_3)_2 OCH_3$	H

	•				
			201		
	SCC1 ₃	Н	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	SCC1 ₃	Εt	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	SCC1 ₃	Εt	СНз	$C (CF_3)_2 OCH_3$	H
	SCC1 ₃	Εt	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
5	SPh	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SNE t 2	Н	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	$SN(Pr-i)_2$	H	CH₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	$SN (Bu-n)_2$	H	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Bu-n) 2	H	CH ₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
10	$SN (Bu-n)_2$	Н	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	H
	T-16	H	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	H
	T-17	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	T-18	H	СНз	CF (CF ₃) ₂	H
	T-18	H	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
15	T-18	H	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	T-23	H	СН₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	$SN (CH_3) C (0) OE t$	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	$SN (CH_3) C (0) OPr-n$	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	$SN (CH_3) C (0) OBu-n$	H	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
20	$SN (CH_3) C (0) OBu-n$	Н	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	SN (CH $_3$) C (0) OBu-n	H	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (CH ₃) C (0) OHex-n	Н	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Et) C (0) OEt	H	СН₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN (Et) C (0) OPr-n	H	СН₃	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
25	SN (Et) C (0) OBu-n	Н	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H
	SN (Pr-i) C (0) OE t	Н	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	H
	SN(Pr-i)C(0)OPr-n	H	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	H
	SN (Pr-i) C (0) OBu-n	H	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	H

30 第5表

$$CH_3$$

$$H$$

$$CF_3$$

$$F$$

$$CF_3$$

$$C = 0$$

$$C = 0$$

$$R^{5-N} = N$$

$$R^{6a} = R^{6b}$$

$$R^{5-N} = 0$$

$$R^{5-N}$$

R ⁵	R ⁶ a	R _e p	R³
H	Н	<u></u> Н	i-Pr
CH ₃	СНз	H	Et
CH ₃	СНз	H	n-Pr
CH ₃	СН3	H	i-Pr
CH ₃	CH ₃	H	c-Pr
CH ₃	CH ₃	H	s-Bu
CH ₃	CH ₃	H	t-Bu
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ Et
CH ₃	CH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	CH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t
CH ₃		H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₃	CH ₃		
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH
СНз	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t
СН₃	СН₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
СН₃	СН₃	H .	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
CH ₃	CH₃	Η	CH (CH ₃) CH ₂ SEt
СНз	CH₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et
CH ₃	CH₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
CH ₃	CH ₃	H	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$
CH ₃	СНз	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt
CH ₃	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OEt
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CHO
CH ₃	CH ₃	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
CH ₃	CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
		H	C (CH ₃) ₂ CN
CH ₃	CH ₃	H	$CH_2C \equiv CH$
CH ₃	CH ₃	H	_
CH ₃	CH ₃		C (CH ₃) ₂ C≡CH
CH ₃	CH ₃	Н	CH ₂ Ph
CH ₃	CH ₃	СНз	i-Pr
СН₃	Et	Н	i-Pr
CH ₃	Et	СН₃	i-Pr
СНз	n-Pr	Н	i-Pr
СНз	i-Pr	H	i-Pr
СНз	c-Pr	H	i–Pr
CH ₃	n-Bu	H	i-Pr
СНз	i-Bu	H	i-Pr
CH ₃	s-Bu	H	i–Pr
CH ₃	c-Bu	H	i-Pr
CH ₃	n-Pen	H	i-Pr
	c-Pen	H	i-Pr
CH ³			
СН₃	CH_2CH_2CI	H	i-Pr

	CH ₃	CF ₃	Н	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ CF ₃	п Н	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	n H	
	CH ₃			i-Pr
5	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ C≡CH	CH ₃	i-Pr
J	-	CH ₂ OPh	H	i-Pr
	CH 3	CH ₂ OCH ₂ Ph	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ SCH ₃	CH ₃	i-Pr
1.0	CH ₃	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH₃	i-Pr
10	CH ₃	CH ₂ SEt	СНз	i-Pr
	CH 3	CH ₂ SPh	CH ₃	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ SO ₂ Ph	CH ₃	i-Pr
	CH 3	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	i-Pr
1.5	CH ₃	C (0) OCH ₃	H	i-Pr
15	CH3	C (0) 0Et	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ C (0) OEt	H	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ C (0) NHCH ₃	СНз	i-Pr
	CH ₃	CH ₂ C (0) N (CH ₃) ₂	CH ₃	i-Pr
	CH ₃	CH=CH ₂	Н	i-Pr
20	CH ₃	CH=CHCH ₃	Н	i-Pr
	CH ₃	CH=C (CH $_3$) $_2$	H	i-Pr
	СНз	$CH_2C \equiv CCH_3$	H	i-Pr
	СНз	CH₂Ph	H	i-Pr
	СНз	ОСН ₃	Н	i-Pr
25	СНз	OE t	H	i-Pr
	СНз	0Pr−n	H	i-Pr
	СНз	M-4a	H	i-Pr
	CH ₃	M-5a	H	i-Pr
	CH ₃	L-1a	H	i-Pr
30	СНз	L-2a	H	i-Pr
	СНз	L-3a	Н	i-Pr
	СНз	L-4a	Н	i-Pr
	СНз	$-CH_2CH_2CH_2CH_2$	_	i-Pr
	СНз	$-CH_2OCH_2CH_2-$		i-Pr
35	CH ₃	$-CH_2SCH_2CH_2-$		i-Pr
	CH3	$-CH_2SO_2CH_2CH_2$		i-Pr
	CH3	$-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$		i-Pr
	СНз	$-CH_2OCH_2CH_2CH_2$: -	i-Pr
	CH ₃	$-CH_2CH_2OCH_2CH_2$: -	i-Pr
40	CH ₃	$-CH_2CH_2SCH_2CH_2$	· -	i-Pr
	Et	СНз	СНз	i-Pr
	Et	Et	Н	i-Pr
	Et	Et	Н	c-Pr
	Et	Et	H	s-Bu
45	Et	Et	H	t-Bu
	Et	Et	H	C (CH ₃) ₂ Et
	Et	Et	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
				,3,23

WO 03/011028 208 Et Εt H CH (CH₃) CH₂ OC (O) NHE t Et Εt H C (CH₃) 2CH₂OCH₃ Et Et H C (CH₃) 2 CH₂ OC (O) NHCH₃ Εt Et H C (CH₃) 2 CH₂ OC (O) NHE t 5 Εt Et H CH (CH₃) CH₂ SCH₃ Εt Et H CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃ Εt Εt H C (CH₃) 2 CH₂ SCH₃ Εt Εt H C (CH₃) 2CH₂SO₂CH₃ Et Εt H C (CH₃) 2 CH₂ NHC (0) OCH₃ 10 Et Et H C (CH₃) ₂ CH₂ NHC (0) OE t Et Εt H CH (CH₃) CH=NOCH₃ Et. Εt H C (CH₃) ₂ CH=NOH Εt Εt Н C (CH₃) 2 CH=NOCH₃ Et Εt H C (CH₃) 2CN 15 Et Et H $CH_2C \equiv CH$ Εt Εt H C (CH₃) 2C≡CH Εt Εt H CH₂Ph Εt Εt CH₃ i-Pr Et Εt CF₃ i-Pr 20 Εt n-Pr H i-Pr Et i-Pr H i-Pr Et c-Pr H i-Pr Εt CH2CH2CI H i-Pr Εt Н CF₃ i-Pr 25 Εt CH₂CF₃ H i-Pr

Εt CH2OCH3 H i-Pr Et CH2OPh H i-Pr Εt CH₂SCH₃ CH₃ i-Pr Et CH2SO2CH3 CH₃ i-Pr 30 Εt CH, SEt CH₃ i-Pr Εt C (0) OCH₃ H i-Pr Εt C (0) OCH₃ H s-Bu Εt C (0) OCH 3 H t-Bu Εt C (0) OCH 3 Н CH (CH₃) CH₂OCH₃ 35 Εt C (0) OCH3 Η CH (CH₃) CH₂OC (O) NHE t Εt C (0) OCH₃ C (CH₃) ₂CH₂OCH₃ H Εt C (0) OCH₃ H C (CH₃) 2 CH₂ OC (O) NHCH₃ Εt C (0) OCH₃ H C (CH₃) ₂CH₂OC (O) NHE t Εt C (0) OCH₃ H

Н

H

H

H

H

H

H

H

C (0) OCH₃

40

45

Et

Εt

Et

Εt

Et

Εt

Εt

Εt

CH (CH₃) CH₂ SCH₃

C (CH₃) 2 CH₂ SCH₃

CH (CH₃) CH=NOCH₃

C (CH₃) 2 CH=NOCH₃

C (CH₃) ₂ CH=NOH

CH (CH₃) CH₂SO₂CH₃

C (CH₃) 2CH₂SO₂CH₃

C (CH₃) ₂ CH₂NHC (0) OCH₃

C (CH₃) ₂ CH₂NHC (0) 0Et

				o (ou) an
	Εt	C (0) OCH ₃	Н	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	C (0) OCH 3	H	CH ₂ C≡CH
	Et	C (0) OCH ₃	H	$C(CH_3)_2C \equiv CH$
	Et	C (0) OE t	H	i-Pr
5	Et	C (0) OEt	H	c-Pr
U	Et	C (O) OEt	Н	s-Bu
	Et	C (0) 0Et	H	t-Bu
		C (0) OEt	H	C (CH ₃) ₂ Et
	Et		H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	C (0) OEt	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t
10	Et	C (0) OE t		C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
	Et	C (0) OEt	H	
	Εt	C (0) 0Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃
	Et	C (O) OE t	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t
	Et	C (0) OE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
15	Et	C (0) 0E t	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	C (0) 0E t	H	CH (CH ₃) CH ₂ SEt
	Et	C (0) 0Et	H	$CH (CH_3) CH_2 SO_2 Et$
	Et	C (0) OE t	H	$C(CH_3)_2CH_2SCH_3$
	Et	C (0) 0Et	H	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 CH_3$
20	Et	C (0) OE t	H	C (CH ₃) 2CH ₂ SEt
40	Et	C (0) OEt	H	C (CH ₃) 2CH ₂ SO ₂ Et
		C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃
	Et	C (O) OE t	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (O) OEt
	Et		H	C (CH ₃) ₂ CHO
	Et	C (0) 0Et	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
25	Et	C (0) 0Et		C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	C (0) 0Et	H	$C (CH_3)_2 CH = NOCH_3$
	Et	C (0) OEt	H	
	Et	C (0) OEt	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	C (0) 0Et	H	CH ₂ C≡CH
30	Et	C (O) OEt	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	Εt	C (O) OE t	H	CH ₂ Ph
	Et	$\mathrm{CH}=\mathrm{CH}_{2}$	H	i-Pr
	Et	ОСН ₃	H	i–Pr
	Εt	OCH₃	H	c-Pr
35	Et	осн з	H	s-Bu
00	Et	OCH ₃	H	t-Bu
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ Et
	Et	0CH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t
40		OCH ₃	H	C (CH ₃) 2 CH ₂ OCH ₃
40	Et		H	C (CH ₃) 2 CH ₂ OC (O) NHCH ₃
	Et	OCH ₃		$C (CH_3)_2 CH_2 OC (O) NHE t$
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	OCH ₃	H	
	Et	OCH ₃	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
45	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SEt
	Et	OCH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et
	Εt	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃

	Et	OCH ₃	Н	C (CH / CH CO CH
		_		C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	ОСН 3	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt
	Et	OCH ₃	H	$C(CH_3)_2CH_2SO_2Et$
	Et	ОСНз	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OCH_3$
5	Et	ОСНз	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OEt$
	Εt	ОСН 3	H	C (CH ₃) ₂ CHO
	Et	осн 3	H	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
	Et	OCH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
10	Et	OCH ₃	H	
10				C (CH ₃) ₂ CN
	Et	OCH3	H	CH ₂ C≡CH
	Et	OCH ₃	H	$C(CH_3)_2C \equiv CH$
	Et	ОСН 3	H	CH ₂ Ph
	Et	OE t	H	i-Pr
15	Et	OE t	H	s-Bu
	Et	0E t	H	t-Bu
	Et	OE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OE t	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t
	Et	0Et	H	C (CH ₃) 2 CH ₂ OCH ₃
20	Et	0Et	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃
20	Et	0Et	H	
	Et			C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t
		0Et	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	0Et	H	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
0.5	Et	OE t	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
25	Et	0E t	Н	$C (CH_3)_2 CH_2 SO_2 CH_3$
	Et	OEt	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OCH_3$
	Et	0E t	H	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OEt$
	Et	OE t	Н	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	0E t	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOH
30	Et	OE t	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
	Et	OE t	H	C (CH ₃) ₂ CN
	Et	0Et	H	CH ₂ C≡CH
	Et	0E t	H	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$
	Et	0Pr−n	H	i-Pr
35	Et	OPr-n	H	s-Bu
00				
	Et	OPr-n	H	t-Bu
	Et	0Pr−n	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃
	Et	OPr-n	Н	CH (CH $_3$) CH $_2$ OC (O) NHE t
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
40	Et	OPr-n	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHCH_3$
	Et	OPr-n	H	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHE t$
	Εt	OPr-n	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃
	Et	OPr-n	Н	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃
45	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃
40	Et	OPr-n	H	
				C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃
	Et	OPr-n	Н	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OEt$

	E1	OD	ττ	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃
	Et	OPr-n	H H	C (CH ₃) CH=NOH
	Et	OPr-n		
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃
-	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ CN
5	Et	OPr-n	H	CH ₂ C≡CH
	Et	OPr-n	H	C (CH ₃) ₂ C≡CH
	n-Pr	CH ₃	H	i-Pr
	n-Pr	CH ₃	СНз	i-Pr
	n-Pr	OCH ₃	H	i-Pr
10	n-Pr	0Et	H	i-Pr
	n-Pr	OPr-n	H	i-Pr
	i-Pr	СНз	H	i-Pr
	i-Pr	CH ₃	СНз	i-Pr
	i-Pr	OCH ₃	Н	i-Pr
15	i-Pr	0E t	H	i-Pr
	i-Pr	OPr-n	Н	i-Pr
	n-Bu	CH ₃	Н	i-Pr
	n-Bu	CH ₃	CH ₃	i-Pr
	n-Bu	OCH ₃	H	i-Pr
20	n-Bu	0Et	H	i-Pr
	n-Bu	OPr-n	H	i-Pr
	i –Bu	H	H	i-Pr
	s-Bu	H	Н	i-Pr
	CH ₂ Pr-c	H	H	i-Pr
25	CH ₂ CF ₃	H	H	i-Pr
	$CH_2CH_2OCH_3$	H	H	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Н	Н	i-Pr
	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	i-Pr
	CH_2C (0) OCH_3	H	H	i-Pr
30	$CH_2CH_2CH_2CH=CH_2$	Н	H	i-Pr
	$CH_2CH_2CH_2C \equiv CH$	Н	H	i-Pr
	CH ₂ Ph	H	H	i-Pr
	СНО	H	Н	i-Pr
	C(0) CH ₃	Н	H	i-Pr
35	C (0) Et	H	Н	i-Pr
	$C(0) CH_2F$	Н	Н	i-Pr
	$C(0)$ CH_2C1	H	H	i-Pr
	$C(0) CH_2OCH_3$	H	H	i-Pr
	$C(0)$ CH_2 SCH_3	H	H	i-Pr
40	C (0) Ph	H	H	i-Pr
	C (0) OCH ₃	H	H	i-Pr
	C (0) OE t	H	Н .	i-Pr
	C(0) SCH ₃	Н	H	i-Pr
	C (0) SEt	H	Н	i-Pr
45	C (O) NHCH ₃	H	Н	i-Pr
	C (0) N (CH ₃) ₂	H	H	i-Pr
	C (S) SCH ₃	H	H	i-Pr
	<u>-</u>			

C (S) SEt	Н	Н	i-Pr
$S0_2CH_3$	Н	Н	i-Pr

5 第6表

	R ⁵	R ³	Υ2	Y ¹ , (Y ³) _n
	CH ₃	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
5	CH ₃	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	CH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	Et	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	Et	n-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	H H	4-SPr-i
	Et	i-Pr	H	4-SBu-i
	Et	i-Pr	C1	4-CH ₃
	Et	i-Pr		2-OCH (CF ₃) ₂
15	Et	i-Pr	CF ₂ CF ₃	2-C1
	Et	i-Pr	CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2 он ₃ Н
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-C1
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-01 ₃ 2-0CH ₃
20	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-OCH ₃ 2-SCH ₃
	Et	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-30n ₃ 4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ Br	4-сп _з 2-сн _з
	Et	i-Pr	OCF 2 CHFC 1	_
25	Et	i-Pr	OCF 2 CHFC 1	2-CH ₃ 4-CH ₃
20	Et	i-Pr	OCF 2 CHFBr	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF 2 CHFBr	_
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCF ₃	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFCF ₃	2-CH ₃ 4-CH ₃
30	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	4-сп _з Н
50	Et	i-Pr	OCH (CF)	
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-C1
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-0CH ₃
35	E t	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
00			OCF 2 CHFOCF 3	2-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF 2 CHFOCF 3	4-CH ₃
	Et	i-Pr	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF	3 2-C1
	Et	i-Pr	OCF CHFOCF CF CF	3 2-CH ₃
40	Et	i-Pr	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
40	Et	i-Pr	0 (Ph-4-Br)	4-CH ₃
	Et	i-Pr	0 (Ph-4-CF ₃)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	0 (Ph-2, 4-Cl ₂)	Н
	Et	i-Pr	$0 (Ph-2-Cl-4-CF_3)$	2-CH ₃
45	Et	i-Pr	0 (L-45b)	2-CH ₃
45	Et	i-Pr	0 (L-45c)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	0 (L-45d)	2-CH ₃
	Et	i-Pr	0 (L-45d)	4-CH ₃

	Et	i-Pr	SCHF ₂	2-CH ₃
	Et	i-Pr	N (CH ₃) C (O) CF ₂ CF ₃	$2-CH_3$
	Et	c-Pr	CH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	c-Pr	$OCH(CF_3)_2$	$2-CH_3$
5	Et	s-Bu	CF (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
	Et	s-Bu	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	t-Bu	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	t-Bu	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	t-Bu	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
1 0	Et	t-Bu	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Εt	t-Bu	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	$2-CH_3$
	Et	C (CH ₃) ₂ Et	CH (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
	Εt	C (CH ₃) ₂ Et	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
15	Εt	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	$4-CH_3$
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	$2-\mathrm{CH_3}$
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
	Εt	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	$4-CH_3$
	Εt	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHCH ₃	OCH (CF $_3$) $_2$	$2-CH_3$
20	Εt	CH (CH ₃) CH ₂ OC (0) NHE t	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Εt	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	$CF(CF_3)_2$	2-CH₃
	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	$CF(CF_3)_2$	4-CH ₃
	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	OCH (CF ₃) ₂	$4-CH_3$
25	Et	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-СН з
	Et	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (O) NHCH_3$	CH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	$C (CH_3)_2 CH_2 OC (0) NHCH_3$	CH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
30	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHE t	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
0.5	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
35	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCF CHFC1	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCF CHFBr	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCF 2 CHFCF 3	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
40	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃ 2-CH ₃
40	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCF CHFOCF CF CF	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF ₃) ₂	
45	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
45	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SE t	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃

	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	$4-CH_3$
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	4-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	2-CH ₃
5	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
Ü	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ Et	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OE t	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	Et	C (CH ₃) ₂ CHO	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	Et	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOH	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
			CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	4-CH ₃
15	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃		4-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	
	Et	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	2-CH ₃
	Et	C (CH ₃) ₂ CN	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH ₂ C≡CH	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	Et	C (CH ₃) ₂ C≡CH	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	Et	CH ₂ Ph	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	n-Pr	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	i-Pr	i-Pr		2-CH ₃
	n-Bu	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
25	i-Bu	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	s-Bu	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	s-Bu	OCH (CF ₃) ₂	2−CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	t-Bu	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
30	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ Et	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (0) NHCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
35	CH ₂ OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	$C(CH_3)_2CH_2SO_2CH_3$	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	$OCH(CF_3)_2$	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CN	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
40	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	CH ₂ OCH ₃	$C(CH_3)_2C \equiv CH$	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	$2-CH_3$
	CH ₂ OEt	s-Bu	CF (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
	CH ₂ OEt	t-Bu	OCH (CF ₃) ₂	$2-CH_3$
45	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ Et	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ OC (O) NHE t	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
				•

	GIL OD:			
	CH ₂ OEt	$C(CH_3)_2CH_2OCH_3$	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHE t	OCH (CF ₃) ₂	•
	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
5	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃		2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ SE t	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt		CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ Et	0 CH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	_	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	$CF(CF_3)_2$	2-CH ₃
10	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
10	CH ₂ OEt	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SEt	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	$C(CH_3)_2CH_2SO_2Et$	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	$C (CH_3)_2 CH_2 NHC (0) OCH_3$	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CH ₂ NHC (0) OEt	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CHO	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	CH ₂ OEt	CH (CH ₃) CH=NOCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	
	CH ₂ OEt	C (CH ₃) 2 CN	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ OEt	CH ₂ C≡CH		2-CH ₃
	CH ₂ OEt	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	CH (CH ₃) OCH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	t-Bu	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃		OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	CH (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
25	CH (CH ₃) OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
20	_	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	$CF(CF_3)_2$	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
9.0	CH (CH ₃) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CN	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
30	CH (CH ₃) OCH ₃	CH ₂ C≡CH	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (CH ₃) OCH ₃	$C (CH_3)_2 C \equiv CH$	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	t-Bu	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
35	CH (Et) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH(Et)OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	
	CH (Et) OCH ₃	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃		2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
40	CH (Et) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	C (CH ₃) ₂ CN	OCH (CF ₃) ₂	2-СН з
	CH (Et) OCH ₃		CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH (Et) OCH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	OTT O OTT	C (CH ₃) ₂ C≡CH	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
15		i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
tu	CH ₂ C≡CH	s-Bu	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	t-Bu	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	$CH_2C \equiv CH$	C(CH ₃) ₂ Et	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
			U, 2	- 0113

WO 03/011028

40

	$CH_2C \cong CH$ $CH_2C \cong CH$	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	$CH_2C = CH$ $CH_2C = CH$	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	C (CH ₃) ₂ CH ₂ OC (O) NHCH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
5	$CH_2C = CH$ $CH_2C = CH$	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
J	CH ₂ C≡CH	CH (CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH CH ₂ C≡CH	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	•	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	C (CH ₃) ₂ CH=NOCH ₃	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	CH ₂ C≡CH	C (CH ₃) ₂ CN	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
10	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CH ₂ C≡CH	C (CH ₃) ₂ C≡CH	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	CHO CH	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	C (0) CH ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-СН _з
	C (0) E t	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
15	C(0) Pr-n	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	C (0) Pr-i	i-Pr	$CF(CF_3)_2$	2-CH ₃
	C (0) Pr-c	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	C(0) Bu-t	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	C (0) CHF $_2$	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
20	C (0) CF 3	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	$C(0) CF_2CI$	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	Ph	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH₃
	C (0) OCH 3	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	C (0) OE t	i-Pr	$CF(CF_3)_2$	2-CH ₃
25	C(0) OPr-n	i-Pr	OCH (CF $_3$) $_2$	2-CH ₃
	C (0) OPr-i	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	$C(0) OCH_2CH_2C1$	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	C (0) OCH_2CF_3	i-Pr	CF (CF ₃) ₂	2-CH ₃
	SCC1 ₃	i-Pr	OCH (CF ₃) ₂	2-CH ₃
30				

本発明化合物は、農園芸作物及び樹木などを加害する所謂農業害虫、家畜、家禽類に 寄生する所謂家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与える所謂衛生害虫、 倉庫に貯蔵された穀物等を加害する所謂貯穀害虫、及び同様の場面で発生、加害するダ 二類、線虫類、軟体動物、甲殻類の何れの害虫も低濃度で有効に防除できる。

35 本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物及び甲殻類には 具体的に、例えば、

コナガ (Plutella xylostella)、タマナヤガ (Agrotis ipsilon)、カブラヤガ (Agrotis segetum)、オオタバコガ (Helicoverpa armigera)、タバコガ (Helicoverpa assulta)、コットンボールワーム (Helicoverpa zea)、タバコバッドワーム (Heliothis virescens)、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、フタオビコヤガ (Naranga aenescens)、タマナギンウワバ (Plusia nigrisigna)、アワヨトウ (Pseudaletia separata)、シロイチモジヨトウ

25

(Spodoptera exigua)、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、コットンリーフワーム (Spodoptera littoralis)、フォールアーミーワーム(Spodoptera frugiperda)、サザン アーミーワーム (Spodoptera eridania)、トマトホーンワーム (Manduca quinquemaculata)、タバコホーンワーム (Manduca sexta)、グレープベリーモス (Endopiza viteana)、ギンモンハモグリガ(Lyonetia prunifoliella malinella)、キン 5 モンホソガ (Phyllonorycter ringoneella)、ミカンハモグリガ (Phyllocnistis citrella)、ワタアカミムシ(Pectinophora gossypiella)、モモシンクイガ(Carposina niponensis)、リンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana faciata)、チャノコカクモン ハマキ(Adoxophyes honmai)、チャハマキ(Homona magnamina)、コドリンガ(Cydla pomonella)、ナシヒメシンクイ(Grapholita molesta)、二カメイガ(Chilo 10 suppressalis)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、ハイマダラノメイガ (Hellula undalis)、ヨーロピアンコーンボーラー(Ostrinia nubilalis)、ソイビーン ルーパー (Pseudoplusia includens)、イラクサギンウワバ (Trichoplusia ni)、アメリカ シロヒトリ (Hyphantria cunea)、モンシロチョウ (Pieris rapae crucivora)、イチモン ジセセリ (Parnara guttata)等の鱗翅目害虫、 15

ドウガネブイブイ (Anomala cuprea)、ヒメコガネ (Anomala rufocuprea)、マメコガネ (Popillia japonica)、コロラドボテトビートル (Lepinotarsa decemlineata)、インゲンテントウ (Epilachna varivestis)、カンシャクシコメツキ (Melanotus tamsuyensis)、タ バコシバンムシ (Lasioderma serricorne)、ヒメヒラタケシキスイ (Epuraea domina)、ニジュウヤホシテントウ (Henosepilachna vigintioctopunctata)、チャイロコメノゴミムシダマシ (Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ (Tribolium castaneum)、ゴマダラカミキリ (Anoplophora malasiaca)、マツノマダラカミキリ (Monochamus alternatus)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata)、アリモドキゾウムシ (Cylas formicarius)、ワタミゾウムシ (Anthonomus grandis)、イネゾウムシ (Ethinocnemus squameus)、アルファルファタコゾウムシ (Hypera postica)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、コクゾウ (Sitophilus zeamais)、シバオサゾウムシ (Sphenophrus venatus vestius)、グラナリーウィービル (Sitophilus granarius)、サザンコーンルートワーム (Diabrotica undecimpunctata)、ウエスタンコーンルートワー

10

15

20

25

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 219

ム (Diabrotica virgifera)、ノーザンコーンルートワーム (Diabrotica barberi)、アオ バアリガタハネカクシ (Paederus fuscipes) 等の鞘翅目害虫、

ナガメ (Eurydema rugosa)、シラホシカメムシ (Eysarcoris ventralis)、クサギカメム シ (Halyomorpha mista) 、ミナミアオカメムシ (Nezara viridula) 、クモヘリカメムシ (Leptocorisa chinensis)、ホソヘリカメムシ(Riptortus clavatus)、コバネヒョウタン ナガカメムシ (Togo hemipterus)、ターニッシュドプラントバグ (Lygus lineolaris)、 コットンフリーホッパー (Psuedatomoscelis seriatus)、ツツジグンバイ (Stephanitis pyrioides)、フタテンオオヨコバイ(Epiacanthus stramineus)、チャノミドリヒメヨコ バイ(Empoasca onukii)、ポテトリーフホッパー(Empoasca fabae)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cinctinceps)、ヒメトビウンカ(Laodelphax striatellus)、トビイロウン カ (Nilaparvata lugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)、ミカンキジラミ (Trioza erytreae)、ナシキジラミ (Psylla pyrisuga)、シルバーリーフコナジラミ (Bemisia argentifolii)、タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、ミカンコナジラミ (Dialeurodes citri)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ワタアブラ ムシ (Aphis gossypii)、ユキヤナギアブラムシ (Aphis pomi)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、オオワラジカイガラムシ (Drosicha corpulenta)、イセリアカイガラ ムシ(Icerya purchasi)、ミカンコナカイガラムシ(Planococcus citri)、クワコナカイ ガラムシ (Pseudococcus comstocki)、ルビーロウムシ (Ceroplastes rubens)、ヤノネカ イガラムシ (Unaspis yanonensis)、トコジラミ (Cimex lectularius) 等の半翅目害虫、 ミカンキイロアザミウマ (Frankliniella occidentalis)、ヒラズハナアザミウマ (Frankliniella intonsa)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミナミ

キイロアザミウマ (Thrips palmi)、ネギアザミウマ (Thrips tabaci) 等の総翅目害虫、

ミカンコミバエ (Dacus dorsalis)、ウリミバエ (Dacus cucurbitae)、チチュウカイミ バエ(Ceratitis capitata)、イネヒメハモグリバエ(Hydrellia griseola)、ナスハモグ リバエ (Liriomyza bryoniae)、マメハモグリバエ (Liriomyza trifolii)、タネバエ (Hylemya platura)、アップルマゴット(Rhagoletis pomonella)、ヘシアンフライ (Mayetiola destructor)、イエバエ (Musca domestica)、サシバエ (Stomoxys calcitrans)、ヒツジシラミバエ (Melophagus ovinus)、ウシバエ (Hypoderma bovis)、キ スジウシバエ(Hypoderma lineatum)、ヒツジバエ(Oestrus ovis)、ツェツェバエ

(Glossina palpalis, Glossina morsitans)、キアシオオプユ (Prosimulium yezoensis)、ウシアブ (Tabanus trigonus)、オオチョウバエ (Telmatoscopus albipunctatus)、トクナガヌカカ (Leptoconops nipponensis)、アカイエカ (Culex pipiens pallens)、ネッタイシマカ (Aedes aegypti)、ヒトスジシマカ (Aedes albopicutus)、シナハマダラカ

5 (Anopheles hyracanus sinesis)等の双翅目害虫、

クリハバチ(Apethymus kuri)、カブラハバチ(Athalia rosae japonensis)、マツノキハバチ(Neodiprion sertifer)、グンタイアリ(Eciton burchelli, Eciton schmitti)、クロオオアリ(Camponotus japonicus)、オオスズメバチ(Vespa mandarina)、ブルドックアント(Myrmecia spp.)、ファイヤーアント類(Solenopsis spp.)、ファラオアント

10 (Monomorium pharaonis)等の膜翅目害虫、

クロゴキブリ(Periplaneta fuliginosa)、ヤマトゴキブリ(Periplaneta japonica)、 チャバネゴキブリ(Blattella germanica)等の網翅目害虫、

エンマコオロギ(Teleogryllus emma)、ケラ(Gryllotalpa africana)、トノサマバッタ(Locusta migratoria)、コバネイナゴ(Oxya yezoensis)、サバクワタリバッタ

15 (Schistocerca gregaria) 等の直翅目害虫、

イエシロアリ (Coptotermes formosanus)、ヤマトシロアリ (Reticulitermes speratus)、タイワンシロアリ (Odontotermes formosanus) 等のシロアリ目害虫、

ネコノミ (Ctenocephalidae felis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)等の等翅目害虫、

20 ニワトリオオハジラミ (Menacanthus stramineus)、ウシハジラミ (Bovicola bovis)等のハジラミ目害虫、

ウシジラミ (Haematopinus eurysternus)、ブタジラミ (Haematopinus suis)、ウシホソジラミ (Linognathus vituli)、ケブカウシジラミ (Solenopotes capillatus)等のシラミ目害虫、

25 ミカンハダニ (Panonychus citri)、リンゴハダニ (Panonychus ulmi)、カンザワハダニ (Tetranychus kanzawai)、ナミハダニ (Tetranychus urticae) 等のハダニ類、

チャノナガサビダニ(Acaphylla theae)、ミカンサビダニ(Aculops pelekassi)、ニセナシサビダニ(Eriophyes chibaensis)、チューリップサビダニ(Aceria tulipae)等のフシダニ類、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 221

チャノホコリダニ (Polyphaotarsonemus latus)、シクラメンホコリダニ (Steneotarsonemus pallidus)等のホコリダニ類、

ケナガコナダニ (Tyrophagus putrescentiae)、ロビンネダニ (Rhizoglyphus robini)等 のコナダニ類、

ミツバチヘギイタダニ (Varroa jacobsoni) 等のハチダニ類、 5

オウシマダニ (Boophilus microplus)、フタトゲチマダニ (Haemaphysalis longicornis) 等のマダニ類、

ヒツジキュウセンダニ (Psoroptes ovis) 等のキュウセンダニ類、

ヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei) 等のヒゼンダニ類、

オカダンゴムシ (Armadillidium vulgare) 等の甲殻類、 10

15

25

キタネグサレセンチュウ (Prathylenchus penetrans)、クルミネグサレセンチュウ (Prathylenchus vulnus)、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis)、ダ イズシストセンチュウ (Heterodera glycines)、キタネコブセンチュウ (Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita)、マツノザイセンチュウ (Bursaphelenchus lignicolus)等の線虫類、

スクミリンゴガイ(Ponacea canaliculata)、ナメクジ(Incilaria bilineata)、ウスカ ワマイマイ (Acusta despecta sieboldiana)、ミスジマイマイ (Euhadra peliomphala) 等 の軟体動物、

等が挙げられるが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

さらに、本発明化合物は、有機燐系化合物、カーバメート系化合物又はピレスロイド 20 系化合物等の既存の殺虫剤に対して抵抗性の発達した害虫に対しても有効である。

すなわち、本発明化合物は、直翅目、アザミウマ目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅 目、双翅目、網翅目、等翅目、シロアリ目、ダニ・シラミ類及び線虫類の害虫を低濃度 で有効に防除することが出来る。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類及び益虫 に対してほとんど悪影響の無い極めて有用な特長を有している。

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、 更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止 剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤(soluble concentrate)、乳剤 (emulsifiable concentrate)、水和剤 (wettable powder)、水 溶剤 (water soluble powder) 、顆粒水和剤 (water dispersible granule) 、顆粒水溶剤 (water soluble granule) 、懸濁剤 (suspension concentrate) 、乳濁剤 (emulsion, oil in water) 、サスポエマルジョン (suspoemulsion) 、マイクロエマルジョン

(microemulsion)、粉剤(dustable powder)、粒剤(granule)およびゲル剤(gel)等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を、水溶性カプセルおよび水溶性フィルムの袋等の水溶性包装体に封入して供することもできる。

5

10

15

20

25

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然 鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等 の無機塩類、合成シリカならびに合成シリケートが挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、アーブチロラクトン等のエステル類、NーメチルピロリドンおよびNーオクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならび

にアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100 重量部に対し、通常0.05~20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤 は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

5 本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異は 有るが、一般には有効成分量としてヘクタール(ha)当たり0.005~50kg 程度が適 当である。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これ らのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味 する。

〔水和剤〕

10

20

本発明化合物0.1~80部固体担体5~98.9部界面活性剤1~10部

15 その他 0~ 5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげれらる。

[乳 剤]

本発明化合物0.1~30部液体担体45~95部界面活性剤4.9~15部

その他 0~10部

〔懸濁剤〕

本発明化合物 0.1~70部

25 液体担体 15~98.89部

界面活性剤 1~12部

その他 0.01~30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

224

本発明化合物 0.1~90部

固体担体 0~98.9部

界面活性剤 1~20部

その他 0~10部

5 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

本発明化合物 0.01~70部

液体担体 20~99.99 部

その他 0~10部

10 その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

本発明化合物 0.01~80部

固体担体 10~99.99部

その他 0~10部

15 その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

本発明化合物

0.01~30部

固体担体

65~99.99部

その他

0~5部

20 その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

次に、本発明化合物を有効成分とする製剤例をより具体的に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、以下の配合例において、「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕水和剤

25 本発明化合物 No. 1-068

20部

パイロフィライト

74部

ソルポール5039

4部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物:東邦化学工業(株)商品 名) WO 03/011028

225

2部

カープレックス#80D

(合成含水珪酸:塩野義製薬(株)商品名) 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

〔配合例2〕乳 剤

5 本発明化合物 No. 1-068 5部

キシレン 75部

N-メチルピロリドン 15部

ソルポール2680 5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物:東邦化学工業(株)商品

10 名)

以上を均一に混合して乳剤とする。

〔配合例3〕懸濁剤

本発明化合物 No. 1-068 25部

アグリゾールS-710 10部

15 (非イオン性界面活性剤:花王(株)商品名)

ルノックス1000C 0.5部

(アニオン性界面活性剤:東邦化学工業(株)商品名)

キサンタンガム 0.2部

水 64.3部

20 以上を均一に混合した後、湿式粉砕して懸濁剤とする。

〔配合例4〕顆粒水和剤

本発明化合物 No. 1-068 75部

ハイテノール NE-15 5部

(アニオン性界面活性剤:第一工業製薬(株)商品名)

25 バニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤:日本製紙(株)商品名)

カープレックス#80D 10部

(合成含水珪酸:塩野義製薬(株)商品名)

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、

乾燥して顆粒水和剤とする。

〔配合例5〕粒 剤

本発明化合物 No. 1-068

5部

ベントナイト

50部

5 タルク

45部

以上を均一に混合粉砕した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、 乾燥して粒剤とする。

〔配合例6〕粉 剤

本発明化合物 No. 1-068

3部

10 カープレックス#80D

0.5部

(合成含水珪酸:塩野義製薬(株)商品名)

カオリナイト

95部

リン酸ジイソプロピル

1.5部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

15 使用に際しては、上記製剤を水で1~10000倍に希釈して、又は希釈せずに直接 散布する。

また、本発明化合物を農薬として使用する場合には、必要に応じて製剤時又は散布時 に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、 肥料、土壌改良剤等と混合施用しても良い。

20 特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の低減による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺虫スペクトラムの拡大やより高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えばファーム・ケミカルズ・ハンドブック(Farm Chemicals Handbook)1999年版に記載されている化合物等が挙げられる。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

殺菌剤: アシベンゾラルーS-メチル(acibenzolar-S-methyl)、アシルアミノベンザミド(acylaminobenzamide)、アンバム(amobam)、アムプロピルホス(ampropyfos)、アニラジン(anilazine)、アザコナゾール(azaconazole)、アゾキシストロビン

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

(azoxystrobin) 、ベナラキシル (benalaxyl) 、ベノダニル (benodanil) 、ベノミル (benomyl)、ベンチアゾール(benthiazole)、ベンザマクリル(benzamacril)、ビナパ クリル(binapacryl)、ビフェニル(biphenyl)、ビテルタノール(bitertanol)、ベ トキサジン(bethoxazine)、ボルドー液(bordeaux mixture)、ブラストサイジン-S (blasticidin-S)、ブロモコナゾール (bromoconazole)、ブピリメート 5 (bupirimate) 、ブチオベート (buthiobate) 、カルシウムポリスルフィド (calcium polysulfide)、キャプタフォール (captafol)、キャプタン (captan)、カッパーオキ シクロリド (copper oxychloride) 、カルプロパミド (carpropamid) 、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシン (carboxin)、CGA-279202 (試験名)、キノメチオ ネート (chinomethionat) 、クロベンチアゾン (chlobenthiazone) 、クロルフェナゾー 10 ル (chlorfenazol) 、クロロネブ (chloroneb) 、クロロタロニル (chlorothalonil) 、 クロゾリネート (chlozolinate)、クフラネブ (cufraneb)、シモキサニル (cymoxanil) 、シプロコナゾール (cyproconazol) 、シプロジニル (cyprodinil) 、シ プロフラム (cyprofuram)、ダゾメット(dazomet)、デバカルブ (debacarb)、ジクロロ フェン (dichlorophen) 、ジクロブトラゾール (diclobutrazol) 、ジクロフラニド 15 (diclhlofluanid)、ジクロメジン (diclomedine)、ジクロラン (dicloran)、ジエト フェンカルブ(diethofencarb)、ジクロシメット(diclocymet)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、ジフルメトリン(diflumetorim)、ジメチリモール (dimethirimol)、ジメトモルフ (dimethomorph)、ジニコナゾール (diniconazole)、 ジニコナゾールーM (diniconazole-M) 、ジノカップ (dinocap) 、ジフェニルアミン 20 (diphenylamine)、ジピリチオン (dipyrithione)、ジタリムホス (ditalimfos)、ジ チアノン (dithianon) 、ドデモルフ (dodemorph) 、ドジン (dodine) 、ドラゾクソロ ン(drazoxolon)、エデフェノホス(edifenphos)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、エタコナゾール (etaconazole)、エチリモル (ethirimol)、エト リジアノール (etridiazole)、ファモキサゾン (famoxadone)、フェナリモル 25 (fenarimol) 、フェブコナゾール (febuconazole) 、フェナミドン (fenamidone) 、 フェンダゾスラム(fendazosulam)、フェンフラム(fenfuram)、フェンヘキサミド (fenhexamid)、フェンピクロニル (fenpiclonil)、フェンプロピジン (fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチン(fentin)、

フェルバン(ferbam)、フェリムゾン(ferimzone)、フルアジナム(fluazinam)、フ ルジオキソニル (fludioxonil) 、フルオロイミド (fluoroimide) 、フルキンコナゾー ル (fluquinconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、フルスルファミド (flusulfamide)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアフォール(flutriafol)、 フォルペット (folpet) 、フォセチルーアルミニウム (fosetyl-aluminium) 、フベリダ 5 ゾール(fuberidazole)、フララキシル(furalaxyl)、フラメトピル(furametpyr)、グ アザチン (guazatine) 、ヘキサクロロベンゼン (hexachlorobenzene) 、ヘキサコナ ゾール(hexaconazole)、ヒメキサゾール(hymexazol)、イマザリル(imazalil)、イ ミベンコナゾール (imibenconazole)、イミノクタジン (iminoctadine)、イプコナ ゾール (ipconazole) 、イプロベンホス (iprobenfos) 、イプロジオン (iprodione) 、 10 イソプロチオラン (isoprothiolane) 、イプロバリカルブ (iprovalicarb) 、カスガマ イシン(kasugamycin)、クレソキシムーメチル(kresoxim-methyl)、マンカッパー (mancopper) 、マンコゼブ (mancozeb) 、マンネブ (maneb) 、メパニピリム (mepanipyrim) 、メプロニル (mepronil) 、メタラキシル (metalaxyl) 、メトコナ ゾール (metconazole) 、メタスルホカルブ (methasulfocarb) 、メチラム (metiram) 、 15 メトミノストロビン (metominostrobin) 、ミクロブタニル (myclobutanil) 、MTF-753 (試験名)、ナバム (nabam)、ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis (dimethyldithiocarbamate))、ニトロタールーイソプロピル (nitrothalisopropyl)、ヌアリモル (nuarimol)、NNF-9425 (試験名)、オクチリノン 20 (octhilinone)、オフレース (ofurace)、オキサジキシル (oxadixyl)、オキシカル ボキシン (oxycarboxin) 、オキポコナゾールフマール酸塩 (oxpoconazole fumarate) 、 ペフラゾエート (pefurzoate) 、ペンコナゾール (penconazole) 、ペンシクロン (pencycuron) 、フタライド (phthalide) 、ピペラリン (piperalin) 、ポリオキシン (polyoxins) 、炭酸水素カリウム(potassium hydrogen carbonate)、プロベナゾール (probenazole)、プロクロラズ (prochloraz)、プロシミドン (procymidone)、プロ 25 パモカルブ塩酸塩(propamocarb hydrochloride)、プロピコナゾール (propiconazole)、プロピネブ (propineb)、ピラゾホス (pyrazophos)、ピリフェ ノックス (pyrifenox) 、ピリメタニル (pyrimethanil) 、ピロキュロン (pyroquilon) 、 キノメチオネート(quinomethionate)、キノキシフェン(quinoxyfen)、キントゼン

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

(quintozene)、RH7281(試験名)、炭酸水素ナトリウム (sodium hydrogen carbonate)、次亜塩素酸ナトリウム (sodium hypochlorite)、硫黄 (sulfur)、スピロキサミン (spiroxamine)、テブコナゾール (tebuconazole)、テクナゼン (tecnazene)、テトラコナゾール (tetraconazole)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チアジア ジン (thiadiazin/milneb)、チフルザミド (thifluzamide)、チオファネートーメチル (thiophanate-methyl)、チラム (thiram)、トルクロホスーメチル (tolclofos-methyl)、トリルフラニド (tolylfluanid)、トリアジメホン (triadimefon)、トリアジメノール (toriadimenol)、トリアゾキシド (triazoxide)、トリシクラゾール (tricyclazole)、トリデモルフ (tridemorph)、トリフルミゾール (triflumizole)、トリホリン (triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、硫酸亜鉛(zinc sulfate)、ジネブ (zineb)、ジラム (ziram) 及びシイタケ菌糸体抽出物など。

殺バクテリア剤:ストレプトマイシン (streptomycin) 、テクロフタラム (tecloftalam)、オキシテトラサイクリン (oxyterracycline) 及びオキソリニックアシド (oxolinic acid) など。

15

殺線虫剤:アルドキシカルブ (aldoxycarb) 、カズサホス (cadusafos) 、フォスチアゼート (fosthiazate) 、フォスチエタン (fosthietan) 、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミホス (fenamiphos) など。

殺ダ二剤:アセキノシル(acequinocyl)、アミトラズ(amitraz)、ビフェナゼート
(bifenazate)、プロモプロピレート(bromopropylate)、チノメチオネート
(chinomethionat)、クロロベンジラート(chlorobezilate)、クロフェンテジン
(clofentezine)、サイヘキサチン(cyhexatine)、ジコフォール(dicofol)、ジエノ
クロール(dienochlor)、エトキサゾール(etoxazole)、フェナザキン(fenazaquin)、フェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンプロキシメート(fenproximate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ヘキシチアゾックス(hexythiazox)、ミルベメクチン(milbemectin)、プロパルギット(propargite)、ピリダベン(pyridaben)、ピリミジフェン(pyrimidifen)及びテブフェンピラド(tebufenpyrad)など。

殺虫剤:アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミピリド

(acetamipirid) 、アルディカルブ (aldicarb) 、アレスリン (allethrin) 、アジンホ スーメチル(azinphos-methyl)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタップ(bensultap)、ビフェントリン(bifenthrin)、ブ プロフェジン(buprofezin)、ブトカルボキシン(butocarboxim)、カルバリル (carbaryl) 、カルボフラン (carbofuran) 、カルボスルファン (carbosulfan) 、カル タップ (cartap) 、クロルフェナピル (chlorfenapyr) 、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルフェンビンホス (chlorfenvinghos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロチアニジン (clothianidin)、クロマフェノジド (chromafenozide)、クロピリホスーメチル(chlorpyrifos-methyl)、シクロプロトリ ン (cycloprothrin) 、シフルトリン (cyfluthrin) 、ベーターシフルトリン (beta-10 cyfluthrin)、シペルメトリン (cypermethrin)、シロマジン (cyromazine)、シハロ トリン (cyhalothrin) 、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin) 、デルタメトリ ン (deltamethrin)、ジアフェンチウロン (diafenthiuron)、ダイアジノン (diazinon)、ジアクロデン (diacloden)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジ メチルビンホス (dimethylvinphos) 、ジオフェノラン (diofenolan) 、ジスルフォトン 15 (disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、EPN、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェ ンカルブ (ethiofencarb) 、エチプロール (ethiprole) 、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトリムホス(etrimfos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、 20 フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノキシカーブ(fenoxycarb)、フェンプロパトリ ン (fenpropathrin) 、フェンバレレート (fenvalerate) 、フィプロニル (fipronil) 、 フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルシトリネート (flucythrinate)、フルフェノ クスウロン(flufenoxuron)、フルフェンプロックス(flufenprox)、タウーフルバリ ネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonophos)、フォルメタネート (formetanate)、フォルモチオン(formothion)、フラチオカルブ(furathiocarb)、 25 ハロフェノジド (halofenozide) 、ヘキサフルムロン (hexaflumuron) 、ヒドラメチル ノン(hydramethylnon)、イミダクロプリド(imidacloprid)、イソフェンホス (isofenphos)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、

イソキサチオン (isoxathion)、ルフェヌウロン (lufenuron)、マラチオン

(malathion) 、メタルデヒド (metaldehyde) 、メタミドホス (methamidophos) 、メチ ダチオン(methidathion)、メタクリホス(methacrifos)、メタルカルブ (metalcarb)、メソミル (methomyl)、メソプレン (methoprene)、メトキシクロール (methoxychlor) 、メトキシフェノジド (methoxyfenozide) 、モノクロトホス (monocrotophos) 、ムスカルーレ (muscalure) 、ニジノテフラン (nidinotefuran) 、 5 ニテンピラム(nitenpyram)、オメトエート(omethoate)、オキシデメトンーメチル (oxydemeton-methyl)、オキサミル(oxamyl)、パラチオン(parathion)、パラチオ ンーメチル (parathion-methyl) 、ペルメトリン (permethrin) 、フェントエート (phenthoate)、フォキシム (phoxim)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスメット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ピリミカ 10 ルブ (pirimicarb) 、ピリミホスーメチル (pirimiphos-methyl) 、プロフェノホス (profenofos) 、プロトリフェンブト (protrifenbute) 、ピメトロジン (pymetrozine)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、 ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofos)、シラフルオフェン 15 (silafluofen) 、スピノサド (spinosad) 、スルホテップ (sulfotep) 、テブフェノジ ド(tebfenozide)、テフルベンズロン(teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthorin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、チアクロプリド(thiacloprid)、チオシクラム (thiocyclam)、チオジカルブ (thiodicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チ オファノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド 20 (tolfenpyrad)、トラロメスリン(tralomethrin)、トリクロルホン(trichlorfon)、 トリアズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン

25 実施例

以下に本発明化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。 [合成例]

合成例1

(vamidothion) など。

 $N'-(4- \wedge)^2 - (1 - \lambda) - N^2 - (1 - \lambda) - (1 -$

工程1;3-アミノー \mathbb{N}^1- (4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル)- \mathbb{N}^2- イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

 N^{1} - $(4-\Lambda \mathcal{T} P \mathcal{T}$

融点215.0~216.0℃

10

20

15 J=8. 2, 0. 8Hz, 1H), 6. 08 (d, J=6. 8Hz, 1H), 4. 59 (bs, 2H), 4. 05-4. 2 (m, 1H), 2. 32 (s, 3H), 1. 05 (d, J=6. 6Hz, 6H).

工程2; \mathbb{N}^1 - (4- \mathbb{N}^2 -イソプロピル-2-メチルフェニル) $-\mathbb{N}^2$ -イソプロピル-3- (1- \mathbb{N}^2 -インプロピル-3- (1- \mathbb{N}^2 -インプロピル-3-

3-Pミノー N^1 ー($4-\Lambda$ プタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) $-N^2-$ イソプロピルフタル酸ジアミド 1. 4gのオルト酢酸トリメチル 5 ml 溶液にパラトルエンスルホン酸 0. 2g を添加し、60 Cにて 30 分攪拌した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去し、残留した固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物 1. 4g を白色結晶として得た。

融点213.0~214.0℃

3-(1-x)キシエチリデンアミノ) $-N^{1}-(4-(2, 2, 2-1))$ フルオロー1

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 233

ーヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-№-イソプロ ピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-114)。

工程1:N-(4-(2,2,2-1)フルオロー1-1ヒドロキシー1-1トリフルオロメ チルエチル)-2-メチルフェニル)-3-ニトロフタルイミドの製造。

3-二トロフタル酸無水物 2.8g 及び4-(2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロ 5 キシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルアニリン(ザ・ジャーナル・オ ブ・オーガニック・ケミストリー [J. Org. Chem.] 1965年、30巻、1001頁記 載の化合物) 4.0g の酢酸50ml 溶液を、加熱還流下にて90分攪拌した。反応完結後、 減圧下にて溶媒を留去、残留物を酢酸エチル200mlに溶解し、水100ml、飽和炭酸 水素ナトリウム水溶液100ml、水100mlの順で洗浄した。有機層を飽和食塩水、無 10 水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥後、減圧下にて溶媒を留去することにより、目的 物の粗生成物6.78gをアメ状固体として得た。このものは、精製することなく次の反 応に用いた。

 ^{1}H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 24 (d, J=7.7Hz, 1H), 8. 20 (d, J=7.7Hz, 1H),

8. 01 (t. J=7. 7Hz. 1H), 7. 74 (s. 1H), 7. 68 (d. J=8. 2Hz, 1H), 7. 30 (d. J=8. 2Hz, 15 1H). 3.67 (bs. 1H). 2.28 (s. 3H).

工程 $2; N^{1}-(4-(2, 2, 2-h))$ フルオロー1ーヒドロキシー1ートリフルオロメ チルエチル)-2-メチルフェニル)-N2-イソプロピル-3-ニトロフタル酸ジアミド の製造。

N-(4-(2, 2, 2-1))20 $f(\mu) = 2 - \lambda f(\mu) + \lambda f(\mu) = 3 - \lambda f(\mu) + \lambda$ 液に、イソプロピルアミン2.5gを添加し、室温にて4日間攪拌した。反応完結後、減 圧下にて溶媒を留去することにより得られた固体を酢酸エチルージイソプロピルエーテ ル混合溶媒にて洗浄し、目的物 3.1gを淡黄色結晶として得た。

融点155.0~157.0℃ 25

> 'H NMR (CDC1₃-DMS0-d₆, Me₄Si, 300MHz) δ 9.89 (s, 1H), 8.66 (bs, 1H), 8.42 (d, J=7.7Hz, 1H), 8.17 (d, J=8.0Hz, 1H), 8.00 (d, J=7.7Hz, 1H), 7.75 (t, J=7.7Hz, 1H), 7.65 (d, J=8.5Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.51 (d, J=8.2Hz, 1H), 3.85-3.95 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.03 (d, J=6.3Hz, 6H).

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

工程 3; 3-Pミノ-N-(4-(2, 2, 2-h)フルオロ-1-hドロキシ-1-hリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N-イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

 N^1 - (4-(2, 2, 2-k) フルオロー1-ヒドロキシー1-kリフルオロメチルエチル) -2 ーメチルフェニル) $-N^2$ ーイソプロピルー3ーニトロフタル酸ジアミド3.0g のメタノール100 ml 溶液に、5%活性炭担持パラジウム0.1g を添加し、常圧水素雰囲気下にて1時間攪拌した。反応完結後、不溶物をセライト濾過、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物2.3g を白色結晶として得た。

10 融点205.0~207.0℃

¹H NMR (CDC1₃-DMSO-d₆, Me₄Si, 300MHz) δ 9. 32 (s, 1H), 8. 61 (s, 1H), 7. 85 (d, J=8. 0Hz, 1H), 7. 74 (d, J=8. 5Hz, 1H), 7. 51 (s, 1H), 7. 14 (d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 15 (t, J=7. 8Hz, 1H), 6. 75-6. 85 (m, 2H), 5. 25 (s, 2H), 3. 85-4. 0 (m, 1H), 2. 30 (s, 3H), 0. 99 (d, J=6. 3Hz, 6H).

15 工程 4; 3-(1-x)+シエチリデンアミノ) $-N^1-(4-(2, 2, 2-1))$ フー 1-1 に 1

3-アミノ-N $^1-$ (4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル)-2-メチルフェニル)-N $^2-$ イソプロピルフタル酸ジアミド 2. 2g

20 のオルト酢酸トリエチル30ml 溶液にパラトルエンスルホン酸0.05gを添加し、80℃にて30分攪拌した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去し、残留した固体をジイソプロピルエーテルーへキサン混合溶媒にて洗浄し、目的物2.3gを白色結晶として得た。融点164.0~166.0℃

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 47 (bs, 1H), 8. 16 (d, J=8. 2Hz, 1H), 7. 5-7. 6 (m, 25 3H), 7. 42 (t, J=7. 7Hz, 1H), 6. 88 (d, J=6. 9Hz, 1H), 5. 88 (d, J=7. 7Hz, 1H), 4. 44 (s, 1H), 4. 20 (q, J=7. 2Hz, 2H), 4. 05-4. 2 (m, 1H), 2. 33 (s, 3H), 1. 88 (s, 3H), 1. 33 (t, J=7. 2Hz, 3H), 1. 10 (d, J=6. 6Hz, 6H).

合成例3

3-エチルアミノー \mathbb{N} - (4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) -

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 235

 \mathbb{N}^2 -イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1 - 0 0 5)。

合成例1にて合成した N¹- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニ \mathcal{W} \mathbb{R}^{1} \mathbb{R}^{1} 4gの酢酸20ml溶液に、撹拌下室温にて、シアノ水素化ホウ素ナトリウム0.33gを 3回に分割して添加した。同温度にて更に1時間攪拌を継続した後水30mlにて希釈、 酢酸エチル30ml にて抽出し、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・ 乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目 的物 0.73g を白色結晶として得た。

融点208.0~209.0℃

- ¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 43 (d, J=8.5Hz, 1H), 7. 58 (s, 1H), 7. 45 (d, 10 J=8. 5Hz, 1H), 7. 41 (s, 1H), 7. 32 (t, J=7. 4Hz, 1H), 6. 88 (d, J=7. 4Hz, 1H), 6. 78 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.10 (d, J=7.7Hz, 1H), 5.43 (bs, 1H), 4.05-4.2 (m, 1H), 3.18 (q, J=7.0Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.28 (t, J=7.0Hz, 3H), 1.03 (d, J=6.6Hz, 6H). 合成例4
- 3-エチルアミノ-N $^{\dagger}-$ (4-(2、2、2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-ト 15 リフルオロメチルエチル) -2-メチルフェニル) -1-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-006)。

合成例2にて合成した3-(1-エトキシエチリデンアミノ)- \mathbb{N}^{1} -(4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-トリフルオロメチルエチル) -2-メチル

- フェニル) $-N^2-4$ ソプロピルフタル酸ジアミド 2.0g の酢酸 13ml 溶液に、撹拌下室 20 温にて、シアノ水素化ホウ素ナトリウム 0.46gを3回に分割して添加した。同温度に て更に50分間攪拌を継続した後、酢酸エチル100ml にて希釈、水50ml ついで飽和 炭酸水素ナトリウム水溶液 5 0 ml にて洗浄した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリ ウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去することにより得られた残留固体を酢酸
- エチルーヘキサン(1:1)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精 25 製し、目的物 1.8gを白色結晶として得た。

融点139.0~140.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 30 (d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 5-7. 6 (m, 3H), 7. 32 (t, J=8. OHz, 1H), 6. 87 (d, J=7. 4Hz, 1H), 6. 76 (d, J=8. 2Hz, 1H), 6. 14 (d, J=7. 7Hz,

PCT/JP02/07833

1H), 5.34 (t, J=4.7Hz, 1H), 4.38 (s, 1H), 4.05-4.15 (m, 1H), 3.1-3.25 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.28 (t, J=6.9Hz, 3H), 1.03 (d, J=6.6Hz, 6H). 合成例 5

3- (N-エチルアセトアミド) -N'- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド (本発明化合物 No. 1-055)。 合成例3にて合成した3-エチルアミノ-N'- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド0.42g及びピリジン0.1g のジクロロメタン20ml 溶液に、氷冷撹拌下、塩化アセチル0.097gを添加し、室温にて12時間攪拌した。反応完結後、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテルーへキサン混合溶媒にて洗浄し、目的物0.34gを白色結晶として得た。

融点144.0~147.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9. 03 and 8. 39 (bs, 1H), 8. 26 and 8. 31 (d, J=8. 2Hz, 1H), 7. 96 and 7. 88 (dd, J=8. 0, 1. 1Hz, 1H), 7. 57 and 7. 60 (t, J=7. 8Hz, 1H), 7. 4–15 7. 5 (m, 2H), 7. 26 and 7. 34 (dd, J=7. 7, 1. 1Hz, 1H), 6. 62 and 5. 73 (d, J=8. 2Hz, 1H), 4. 1–4. 25 (m, 1H), 3. 7–3. 85 and 4. 25–4. 4 (m, 1H), 3. 55–3. 7 and 3. 05–3. 2 (m, 1H), 2. 40 and 2. 38 (s, 3H), 2. 26 and 1. 87 (s, 3H), 1. 25 and 1. 17 (t, J=7. 2Hz, 3H), 1. 09 and 1. 16 (d, J=6. 6Hz, 6H).

合成例5と同様に合成した3-(2-クロローN-エチルアセトアミド)ーN¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル)ーN²-イソプロピルフタル酸ジアミ ド(本発明化合物 No. 1-086)0.39gのN,N-ジメチルホルムアミド5ml溶液に炭酸カリウム0.14gを添加し、室温にて3時間攪拌した。反応完結後、ジエチルエーテル50mlにて希釈し、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物0.26gを白色結晶として得た。

融点138.0~140.0℃

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 38 (bs, 1H), 8. 30 (d, J=8. 1Hz, 1H), 7. 4-7. 65 (m, 3H), 7. 39 (bs, 1H), 7. 3-7. 4 (m, 1H), 4. 8-5. 0 (m, 1H), 4. 2-4. 35 (m, 1H), 3. 87 (s, 2H), 3. 6-3. 8 (m, 1H), 2. 43 (s, 3H), 1. 2-1. 3 (m, 9H).

5 合成例 7

 $3-(N-エチルアセトアミド)-N^1-(4-(1, 1, 2-トリフルオロ-2-(へ プタフルオロプロピルオキシ)エトキシ)-2-メチルフェニル)-N^2-イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. <math>1-0.6.8$)。

合成例2及び4と同様に合成した3-エチルアミノーN!- (4-(1, 1, 2-トリフルオロ-2-(ヘプタフルオロプロピルオキシ) エトキシ) -2-メチルフェニル) ーN²-イソプロピルフタル酸ジアミド7.40g及びピリジン1.04gのジクロロメタン70 ml 溶液に、氷冷撹拌下、塩化アセチル1.04gを添加し、室温にて35分攪拌した。反応完結後、反応混合物に氷水100mlを加え有機層を分取、水層はクロロホルム150 ml にて抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチルーヘキサン(1:4)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物6.75gを白色結晶として得た。

融点84.0~86.0℃

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 87 and 8. 32 (bs, 1H), 7. 9–7. 95 (m, 1H), 7. 65 20 and 7. 92 (d, J=7. 8Hz, 1H), 7. 53 (t, J=8. 1Hz, 1H), 7. 31 and 7. 24 (dd, J=7. 5, 0. 9Hz, 1H), 7. 04 (bs, 2H), 6. 67 and 6. 42 (d, J=8. 1Hz, 1H), 6. 07 (dt, J=53. 4, 2. 7Hz, 1H), 4. 2–4. 4 and 3. 05–3. 2 (m, 1H), 4. 05–4. 2 and 4. 1–4. 25 (m, 1H), 3. 55–3. 75 and 3. 6–3. 8 (m, 1H), 2. 34 and 2. 31 (s, 3H), 2. 25 and 1. 86 (s, 3H), 1. 25 and 1. 15 (t, J=7. 2Hz, 3H), 1. 08 and 1. 09 (d, J=6. 6Hz, 6H).

25 合成例 8

3-エチル(メチル)アミノ-N $^{1}-$ (4-(1, 1, 2-トリフルオロ-2-(ヘプタフルオロプロピルオキシ)エトキシ)-2-メチルフェニル)-N $^{2}-$ イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-0 4 5)。

合成例2及び4と同様に合成した3-エチルアミノーN-(4-(1, 1, 2-トリフ

ルオロー2-(ヘプタフルオロプロピルオキシ)エトキシ)-2-メチルフェニル)ーパーイソプロピルフタル酸ジアミド 0.70g及び37%ホルムアルデヒド水溶液 0.45gのアセトニトリル25ml 縣濁液に、室温にてシアノ水素化ホウ素ナトリウム 0.21gを添加し、更に酢酸 0.2mlを10分間にわたって滴下した。室温にて3時間攪拌を継続した後、反応混合物にジエチルエーテル30ml及び1N水酸化カリウム水溶液30mlを加え有機層を分取、水層はさらにジエチルエーテル30mlを用いて抽出した。有機層を合わせて飽和食塩水、無水硫酸マグネシウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチルーへキサン(1:1)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 0.56gを白色結晶として得た。

10 融点127.0~132.0℃

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 400MHz) δ 8. 34 (bs, 1H), 8. 04 (d, J=8. 4Hz, 1H), 7. 35–7. 5 (m, 2H), 7. 22 (d, J=7. 0Hz, 1H), 6. 95–7. 1 (m, 2H), 6. 40 (d, J=7. 2Hz, 1H), 6. 06 (td, J=53. 6, 2. 6Hz, 1H), 4. 15–4. 3 (m, 1H), 3. 08 (q, J=7. 2Hz, 2H), 2. 75 (s, 3H), 2. 34 (s. 3H), 1. 16 (d, J=6. 4Hz, 6H), 1. 09 (t, J=7. 2Hz, 3H).

15 合成例 9

5

N- $(4-\Lambda \mathcal{I} \not = 0)$ ルオロイソプロピルー $2-\mathcal{I} \not= 0$ フロピルー $4-\mathcal{I} \not= 0$ フロピルー $4-\mathcal{I} \not= 0$ No. 5-0 0 8)。

合成例3にて合成した3-エチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2
 20 -メチルフェニル) -N²-イソプロピルフタル酸ジアミド0.33g及びピリジン0.23 gのジクロロメタン20ml 溶液に、氷冷撹拌下、クロロメチルメチルエーテル0.23gを添加し、室温にて12時間攪拌した。反応完結後、水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチルーへキサン(1:2)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、

25 目的物 0.26gを白色結晶として得た。

融点 9 6. 0~9 8. 0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 40 (br, 1H), 7. 83 (bs, 1H), 7. 65 (d, J=8. 2Hz, 1H), 7. 35-7. 45 (m, 2H), 7. 01 (d, J=7. 4Hz, 1H), 6. 87 (d, J=8. 2Hz, 1H), 4. 85-4. 95 (m, 1H), 4. 41 (s, 2H), 3. 45 (q, J=7. 1Hz, 2H), 2. 33 (s, 3H), 1. 25 (t, J=7. 1Hz, 2Hz, 2Hz)

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 239

3H). 1. 19 (d. J=6.8Hz, 6H).

合成例10

5

10

N- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -1-エチル-3-イ ソプロピルー2-メチルー4-オキソー1,2,3,4-テトラヒドロキナゾリン-5 -カルボキサミド(本発明化合物 No. 7-001)。

合成例3にて合成した3-エチルアミノ-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2 -メチルフェニル)-№-イソプロピルフタル酸ジアミド0.13g及びアセトアルデヒ ド5ml に、パラトルエンスルホン酸 0.0 lg を添加し、室温にて 1 2 時間攪拌した。反 応完結後、ジエチルエーテル20mlを加えて希釈後水洗、有機層を飽和食塩水、無水硫 酸ナトリウムの順で脱水・乾燥、減圧下にて溶媒を留去した。残留固体を酢酸エチルー ヘキサン(2:3)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目 的物 0.13g を乳白色結晶として得た。

融点91.0~93.0℃

 ^{1}H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 43 (br, 1H), 8. 07 (bs, 1H), 7. 46 (d, J=8. 5Hz, 1H), 7.3-7.45 (m, 2H), 7.03 (d, J=7.4Hz, 1H), 6.82 (d, J=8.2Hz, 1H), 4.85-4.95 15 (m, 1H), 4.74 (q, J=6.0Hz, 1H), 3.4-3.6 (m, 1H), 3.15-3.3 (m, 1H), 2.35 (s, 3H), 1. 30 (t, J=7.1Hz, 3H), 1. 15–1. 4 (m, 9H).

合成例11

3-ジメチルアミノ-N'-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) $-N^2$ ーイソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-042)。 20

合成例1の工程1にて合成した3-アミノーN-(4-ヘプタフルオロイソプロピルー 2-メチルフェニル) -№-イソプロピルフタル酸ジアミド 0.97g 及び37%ホルム アルデヒド水溶液 1.6gのアセトニトリル30ml 縣濁液にシアノ水素化ホウ素ナトリウ ム0.38gを添加し、室温にて30分撹拌した後、酢酸0.5mlを10分間にわたって 滴下、更に室温にて3時間攪拌を継続した。反応完結後ジエチルエーテル100mlで希 25 釈し、IN水酸化カリウム水溶液にて洗浄(20mlx3)、有機層を飽和食塩水、無水硫酸 ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。残留物を酢酸エチルーへ キサン(1:1)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的 物 0.53gを白色結晶として得た。

融点216.0~219.0℃

 1 H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 44 (bs, 1H), 8. 33 (d, J=8. 2Hz, 1H), 7. 35-7. 5 (m, 4H), 7. 22 (d, J=8. 2Hz, 1H), 6. 36 (bs, 1H), 4. 15-4. 25 (m, 1H), 2. 86 (s, 6H), 2. 39 (s, 3H), 1. 16 (d, J=6. 5Hz, 6H).

5 合成例12

3-アセトアミドー \mathbb{N}^1- (4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)- \mathbb{N}^2- イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-028)。

合成例1の工程1にて合成した3-アミノーN¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル)ーN²-イソプロピルフタル酸ジアミド0.55g及びトリエチルア 10 ミン0.25gのジクロロメタン30ml 溶液に、氷冷撹拌下、塩化アセチル0.16gを添加し、室温に昇温後12時間攪拌を継続した。反応完結後、水10mlにて洗浄、有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去した。 残留した固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物0.2gを白色結晶として得た。

15 融点208.0~210.0℃

 1 H NMR (CDCl $_{3}$, Me $_{4}$ Si, 300MHz) δ 9. 01 (bs, 1H), 8. 3–8. 45 (m, 2H), 7. 60 (s, 1H), 7. 54 (t, J=8. 0Hz, 1H), 7. 53 (d, J=7. 9Hz, 1H), 7. 43 (s, 1H), 7. 37 (d, J=7. 7Hz, 1H), 6. 39 (d, J=7. 7Hz, 1H), 4. 05–4. 2 (m, 1H), 2. 32 (s, 3H), 2. 19 (s, 3H), 1. 07 (d, J=6. 6Hz, 6H).

20 合成例13

 $N^1-(4-\Lambda プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N^2-イソプロピルー3-(N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド (本発明化合物 No. <math>1-0$ 49) 及び $N^1-(4-\Lambda プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) -N^2-イソプロピル-6-(N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド (本発明化合物 No. <math>2-0$ 03)。

25 工程1; 3-ホルムアミドーN- (4-ヘプタフルオロイソプロピルー2-メチルフェニル) フタル酸イミドの製造。

ギ酸 0.97g 及び無水酢酸 1.6g の混合物を 50 ℃にて 1 時間攪拌した後、氷冷撹拌下、 3- アミノ- N- (4- ヘプタフルオロイソプロピル- 2- メチルフェニル)フタル酸イミド 2.2g のテトラヒドロフラン 20 ml 溶液を添加し、更に室温にて 12 時間撹拌

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 241

を継続した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留物を酢酸エチル30mlに溶解、飽 和炭酸水素ナトリウム水溶液 2 0 ml にて洗浄した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナト リウムの順で脱水・乾燥し、減圧下にて溶媒を留去し、粗製の目的物2.2gを白色結晶 として得た。

5 融点202.0~205.0℃

15

25

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 9. 49 (s, 1H), 8. 88 (d, J=8. 5Hz, 1H), 8. 58 (s, 1H), 7. 80 (t, J=7. 4Hz, 1H), 7. 68 (d, J=7. 1Hz, 1H), 7. 62 (s, 1H), 7. 58 (d, J=8. 5Hz, 1H), 7. 34 (d, J=8.5Hz, 1H), 2. 30 (s, 3H).

工程2;N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-3-(N-メ 10 チルホルムアミド) フタル酸イミドの製造。

3-ホルムアミドーN-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フ タル酸イミド 2.2g のジメチルホルムアミド 30 ml 溶液に、氷冷撹拌下、60%油性水 素下ナトリウム 0.2g を添加し同温度にて 10分間撹拌、続けてヨウ化メチル 0.9g を 添加し、室温に昇温後、更に 1.5 時間撹拌を継続した。反応完結後、氷水 30 ml に投入 しジエチルエーテル30mlにて2回抽出した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウ ムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留固体をジイソプロピルエーテルーへ キサン(1:2)混合溶媒にて洗浄し、目的物1.78gを淡黄色結晶として得た。 融点111.0~114.0℃

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8.51 (s, 1H), 7.93 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.88 (t,

J=7. 4Hz, 1H), 7. 61 (s, 1H), 7. 57 (d, J=7. 6Hz, 1H), 7. 57 (d, J=7. 4Hz, 1H), 7. 35 20 (d, J=8.2Hz, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).

工程3;№-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-№-イソプロ ピルー3- (N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド及び N- (4-ヘプタフルオロ イソプロピルー2ーメチルフェニル) $-\mathbb{N}^2$ ーイソプロピルー6ー $(\mathbb{N}$ ーメチルホルムアミ ド)フタル酸ジアミドの製造。

 $N-(4-\gamma^2\beta^2)$ ルムアミド) フタル酸イミド 0.6gの1,4-ジオキサン20ml 溶液にイソプロピルア ミン1.8mlを添加し、50℃にて7時間攪拌した。反応完結後室温まで放冷、減圧下に 溶媒を留去、残留固体を酢酸エチル続けて酢酸エチルーメタノール(19:1)にて溶

出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、酢酸エチルフラクションより $\mathbb{N}^1-(4-\mathbb{N}^2-\mathbb{N}$

5 2-メチルフェニル)-N $^2-$ イソプロピル-3-(N-メチルホルムアミド)フタル酸ジアミド 0.03g を樹脂状固体として、それぞれ得た。

 $N'-(4-\Lambda プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) <math>-N^2- イソプロピル-6$ -(N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド;

融点191.0~193.0℃

- 10 H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 34 and 8. 13 (d, J=8. 5Hz, 1H), 8. 22 and 8. 28 (s, 1H), 7. 91 and 7. 82 (bs, 1H), 7. 70 and 7. 58 (dd, J=7. 7, 1. 1Hz, 1H), 7. 5-7. 65 (m, 1H), 7. 35-7. 55 (m, 2H), 7. 31 and 7. 38 (dd, J=7. 7, 1. 1Hz, 1H), 6. 13 and 6. 01 (d, J=6. 5Hz, 1H), 4. 15-4. 4 (m, 1H), 3. 33 and 3. 28 (s, 3H), 2. 32 and 2. 33 (s, 3H), 1. 15 and 1. 13 (d, J=6. 6Hz, 6H).
- 15 N^{1} (4- \wedge プタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル) $-N^{2}$ -イソプロピル-3 (N-メチルホルムアミド) フタル酸ジアミド;

 1 H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 300MHz) δ 8. 81 and 8. 45 (bs, 1H), 8. 31 and 8. 29 (d, J=8. 5Hz, 1H), 8. 25 (s, 1H), 7. 97 and 7. 87 (d, J=8. 0Hz, 1H), 7. 55–7. 7 (m, 1H), 7. 4–7. 5 (m, 2H), 7. 39 and 7. 33 (d, J=7. 7Hz, 1H), 6. 39 and 5. 77 (d, J=7. 5Hz, 1H), 3. 35 and

20 3. 28 (s, 3H), 2. 40 and 2. 39 (s, 3H), 1. 11 (d, J=6. 6Hz, 6H).

合成例14

3-(3,3-i)メチルー2-iオーソアゼチジンー1-iイル) $-N^1-(4-i)$ タフルオロイソプロピルー2-iメチルフェニル) $-N^2-i$ イソプロピルフタル酸ジアミド(本発明化合物 No. 1-097)。

25 工程1;2-(2-クロロ-1,1-ジメチルプロパノイルアミノ)-N-イソプロピル ベンズアミドの製造。

2-PミノーNーイソプロピルベンズアミド 6.0g 及びトリエチルアミン 6.81g の ジクロロメタン 40m 溶液に、氷冷攪拌下、ジクロロメタン 30m に溶解した 2- クロロー 1 、1-ジメチルプロパノイルクロライド 6.26g を滴下し、滴下終了後室温にて

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

さらに12時間攪拌を継続した。反応完結後、反応混合物を酢酸エチル200mlにて希釈し、水100ml、1N塩酸50ml、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液50mlの順で洗浄、さらに飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残留する赤色固体をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、目的物8.4gを肌色結晶として得た。

融点134.0~136.0℃

5

15

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 400MHz) δ 11. 41 (bs, 1H), 8. 59 (dd, J=8. 0, 1. 2Hz, 1H), 7. 4-7. 5 (m, 2H), 7. 05-7. 1 (m, 1H), 6. 10 (d, J=6. 4Hz, 1H), 4. 2-4. 3 (m, 1H), 3. 71 (s, 2H), 1. 43 (s, 6H), 1. 28 (d, J=6. 4Hz, 6H).

10 工程 2; 2 - (3, 3 - ジメチル - 2 - オキソアゼチジン - 1 - イル) - N - イソプロピルベンズアミドの製造。

2-(2-クロロ-1, 1-ジメチルプロパノイルアミノ) -N-イソプロピルベンズ アミド8.06gのジクロロメタン87ml 溶液にテトラブチルアンモニウムブロマイド0.87gを添加し、室温にて攪拌下、水酸化ナトリウム34.7gの水87ml 溶液を滴下した。室温にてさらに9時間攪拌を継続した後、反応混合物に水200mlを加えジクロロメタン層を分取、水層はさらにジクロロメタンにて抽出(100mlx2)した。有機層を合わせて無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留した褐色油状物質を酢酸エチルーノルマルヘキサン(2:3)にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物6.26gを乳白色結晶として得た。

20 融点129.5~131.0℃

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 400MHz) δ 7. 75–7. 8 (m, 1H), 7. 35–7. 4 (m, 2H), 7. 1–7. 2 (m, 1H), 6. 03 (d, J=7. 2Hz, 1H), 4. 17–4. 3 (m, 1H), 3. 56 (s, 2H), 1. 38 (s, 6H), 1. 26 (d, J=6. 4Hz, 6H).

工程3;3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)-2-イソプロ 25 ピルカルバモイル安息香酸の製造。

2-(3,3-i)メチルー2-iオキソアゼチジンー1-iイル)-N-iイソプロピルベンズアミド 5.83g のテトラヒドロフラン 6.7 ml 溶液に、-7.8 \mathbb{C} にて攪拌下、0.99 Mセカンダリーブチルリチウムへキサン溶液 5.0 ml を滴下した。-7.8 \mathbb{C} にて 1 時間攪拌を継続した後、室温に昇温、炭酸ガスを 3.0 分間導入した。さらに室温にて 1 時間攪

拌を継続した後、氷冷下に水150ml を加え、濃塩酸を加えて pH を2~3に調節した後、酢酸エチルにて抽出(100ml x 3)した。有機層を飽和食塩水、無水硫酸ナトリウムの順で脱水・乾燥し、減圧下に溶媒を留去、残留した黄色固体をジエチルエーテルにて洗浄し、目的物3.38gをレモン色結晶として得た。

5 工程4;3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)- \mathbb{N}^1 -(4- \mathbb{N}^2 -イソプロピルー2-メチルフェニル)- \mathbb{N}^2 -イソプロピルフタル酸ジアミドの製造。

3-(3,3-ジメチル-2-オキソアゼチジン-1-イル)-2-イソプロピルカルバモイル安息香酸 1.0gのトルエン22ml 溶液に、室温にて攪拌下、無水トリフルオロ酢酸 0.9 3gを滴下した。同温度にて30分攪拌した後、減圧下に溶媒を留去、残留する黄色油状物質をテトラヒドロフラン25ml に溶解、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリン0.9gを添加し、室温にて17時間攪拌を継続した。反応完結後、減圧下に溶媒を留去、残留した黄色固体を酢酸エチル-ノルマルヘキサン(1:

2) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物1.06gを 白色結晶として得た。

融点217.0~217.5℃

15

¹H NMR (CDC1₃, Me₄Si, 400MHz) δ 8. 35 (d, J=8. 4Hz, 1H), 8. 21 (bs, 1H), 8. 07 (dd, J=7. 8, 1. 4Hz, 1H), 7. 38-7. 55 (m, 4H), 6. 37 (d, J=8. 0Hz, 1H), 4. 07-4. 23 (m, 1H), 3. 62 (s, 2H), 2. 37 (s, 3H), 1. 39 (s, 6H), 1. 10 (d, J=6. 8Hz, 6H).

20 本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。そのような 化合物の例を第7表~第14表に示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、表中 Et との記載はエチル基を表し、以下同様に n-Pr 又は Pr-n はイソプロピル基を、i-Pr 又は Pr-i はイソプロピル基を、n-Bu 又は Bu-n はノルマルブチル基を、s-Bu 又は Bu-s はセカンダリーブチル基を、i-Bu 又は Bu-i はイソブチル基を、t-Bu 又は Bu-t

25 はターシャリーブチル基を、c-Pen 又は Pen-c はシクロペンチル基を、c-Hex 又は Hex-c はシクロヘキシル基を、Ph はフェニル基をそれぞれ表し、

また、表中 T-22 及び T-25 は、それぞれ下記の構造を表し、

T-22:
$$-N$$

$$T-25: -N$$

$$C$$

$$CH_3$$

さらに、表中 L-la、L-l4b、L-45c 及び L-45d は、それぞれ下記の構造を表す。

L-1a:
$$CF_3$$
 L-45c: CF_3 L-45c: CF_3 L-45c: CF_3

第7表

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 \\
HN \\
C \\
C \\
C \\
C \\
CH_3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
Y^2 \\
C \\
C \\
C \\
CH_3
\end{array}$$

	No.	X 1	Y 1	Υ ²	m.p. (℃)
	1-001	NHE t	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	153. 0-158. 0
	1-002	NHE t	Br	C (CF ₃) ₂ OH	90. 0-92. 0
0	1-003	NHE t	Br	OCF 3	164. 5-165. 5
	1-004	NHE t	CH ₃	Н	183. 0-185. 0
	1-005	NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	208. 0-209. 0
	1-006	NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OH	139. 0-140. 0
	1-007	NHE t	CH ₃	C (CF ₃) ₂ OCH ₃	201. 0-202. 0
5	1-008	NHE t	CH ₃	OCF ₃	188. 0-190. 0
	1 - 009	NHE t	CH ₃	OCF ₂ Br	186. 0-187. 0
	1-010	NHE t	CH ₃	OCF ₂ CHFC1	167. 0-169. 0
	1-011	NHE t	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3	173. 0-174. 0
	1-012	NHEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	147. 0-148. 0
0	1-013	NHE t	CH ₃	0 (L-45d)	217. 0-218. 0
	1-014	NHE t	CH ₃	L-45d	196. 0-197. 0
	1-015	NHE t	CF ₃	OCF_CHFOCF_CF_CF_	159. 0-163. 0
	1-016	NHE t	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	149. 5-151. 0
	1-017	NHPr-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	193. 0-195. 0
5	1-018	NHBu-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	172. 0-173. 0

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

246

	1-019	NHPen-c	СНз	CF (CF ₃) ₂	197. 0-199. 0
	1-020	NHCH ₂ OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	175. 0-178. 0
	1-021	NHCH ₂ OE t	CH3	CF (CF ₃) ₂	173. 0-174. 0
	1-022	NHCH ₂ OE t	CH3	OCF2CHFOCF2CF2CF3	115. 0-120. 0
5	1-023	——————————————————————————————————————	CH₃	CF (CF ₃) ₂	170. 0-172. 0
	1-024		CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191. 0-193. 0
	1-025	NHCH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	200. 0-202. 0
	1-026	$NHCH_2$ (L-1a)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	196. 0-199. 0
	1-027	NHCHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	189. 0-191. 0
10	1-028	NHC (0) CH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	208. 0-210. 0
	1-029	NHC (0) Bu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	184. 0-187. 0
	1-030	NHC (0) C (CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	СНз	CF (CF ₃) ₂	198. 5-200. 5
	1-031	NHC (0) CF ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	239. 0-240. 0
	1-032	NHC (0) Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	211. 0-213. 0
15	1-033	NHC (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	195. 0-196. 0
	1-034	NHC (0) OBu-i	СНз	CF (CF ₃) ₂	180. 0-181. 0
	1-035	NHC (0) OCH 2 CH 2 C1	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	178. 0-180. 0
	1-036	NHC (0) OCH ₂ CCl ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	223. 5-224. 5
	1-037	NHC (0) C (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	156. 0-157. 0
20	1-038	NHC (0) C (0) OE t	CH3	CF (CF ₃) ₂	212. 0-213. 0
	1-039	NHOH	СНз	CF (CF ₃) ₂	175. 0-177. 0
	1-040	NHSCC1 ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191. 0-193. 0
	1-041	NHSO ₂ CF ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	194. 0-197. 0
	1-042	$N(CH_3)_2$	CH3	CF (CF ₃) ₂	216. 0-219. 0
25	1-043	N (CH ₃) Et	CH3	CF (CF ₃) ₂	187. 0-188. 0
	1-044	N (CH ₃) Et	СНз	C (CF ₃) ₂ OH	178. 0-180. 0
	1-045	N (CH ₃) Et	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	127. 0-132. 0
	1-046	$N(Et)_2$	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	110. 0-111. 0
	1-047	N (CH $_3$) Bu-n	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	206. 0-207. 0
30	1-048	T-22	СНз	CF (CF ₃) ₂	211. 0-212. 0
	1-049	N (CH ₃) CHO	СНз	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	1-050	N (Et) CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	190. 0-192. 0
	1-051	$N (CH_3) C (O) CH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂	170. 0-171. 0
	1-052	N (Et) C (0) CH ₃	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	149. 0-154. 0
35	1-053	N (Et) C (0) CH ₃	Br	$C(CF_3)_2OH$	201. 0-202. 0
	1-054	N (Et) C (0) CH ₃	Br	OCF ₃	217. 0-217. 5
	1-055	$N (Et) C (0) CH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂	144. 0-147. 0
	1-056	$N (Et) C (0) CH_3$	СНз	$C(CF_3)_2OH$	222. 0-223. 0
	1-057	N (Et) C (0) CH ₃	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	124. 0-126. 0
40	1-058	N (Et) C (0) CH ₃	СН₃	OCF ₃	94. 0-96. 0
	1 - 059	$N (Et) C (0) CH_3$	СНз	OCF ₂ Br	85. 0-87. 0
	1-060	$N (Et) C (O) CH_3$	СНз	OCF 2 CHFC 1	100. 0-102. 0
	1-061	$N(Et)C(0)CH_3$	СНз	OCF ₂ CHF ₂	141. 0-143. 0
	1-062	$N (Et) C (0) CH_3$	СНз	OCF ₂ CF ₂ Br	179. 0-181. 0
4 5	1-063	$N (Et) C (0) CH_3$	СНз	OCF ₂ CCl ₃	201. 0-203. 0
	1-064	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCH (CF $_3$) $_2$	197. 0-199. 0
	1-065	$N (Et) C (0) CH_3$	CH ₃	OCF 2 CHFCF 3	146. 0-148. 0

	1-066	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ CFBrCF ₃		174. 0-176. 0
	1-067	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 3		171. 0-172. 0
	1-068	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3		84. 0-86. 0
	1-069	N (Et) C (0) CH ₃	CH3	0 (L-45d)		109. 0-110. 0
5	1-070	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	L-45d	3	177. 0-179. 0
J		N (Et) C (0) CH ₃	CF ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3		148. 0-149. 0
	1-071	-	OCH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3		120. 0-121. 5
	1-072	N (Et) C (0) CH ₃	_	-		180. 0-182. 0
	1-073	N (Et) C (0) CH ₃	L-14b	CF ₃		樹脂状
	1-074	N (Pr-n) C (0) CH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂		102. 0-105. 0
10	1-075	$N (Pr-i) C (0) CH_3$	CH3	CF (CF ₃) ₂		
	1 - 076	N (Bu-n) C (0) CH_3	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		樹脂状
	1-077	$N (Pen-c) C (0) CH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂		98. 0-102. 0
	1-078	N (CH2Ph) C (0) CH3	СНз	CF (CF ₃) ₂		162. 0-166. 0
	1 - 079	N (OC (O) CH_3) C (O) CH_3	СНз	$CF(CF_3)_2$		178. 0-179. 0
15	1-080	N (Et) C (0) Et	СНз	$CF(CF_3)_2$		184. 0-186. 0
	1-081	N (Et) C (0) Pr-n	CH 3	CF (CF ₃) ₂		127. 0-130. 0
	1-082	N (Et) C (0) Pr-i	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		159. 0–163 . 0
	1-083	N (Et) C (0) Pr-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		162. 0-168. 0
	1-084	N (Et) C (0) Bu-t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		樹脂状
20	1-085	N (Et) C (0) Hex-c	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		146. 0-149. 0
	1-086	N (Et) C (0) CH ₂ Cl	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		樹脂状
	1-087	N (Et) C (0) CF ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂		208. 0-210. 0
	1-088	N (Pr-n) C (0) CH_2OCH_3	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		166. 0-168. 0
	1-089	N (Et) C (0) CH ₂ C (0) OEt	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		194. 0-196. 0
25	1-090	N (Et) C (0) CH=CHCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		171. 0-172. 0
20	1-091	N (Et) C (0) Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		197. 0-200. 0
	1-092	N (Et) C (0) (Ph-2-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		179. 0-181. 0
	1-093	N (Et) C (0) (Ph-3-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		168. 0-170. 0
	1-094	N (Et) C (0) (Ph-4-C1)	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		167. 0-169. 0
30	1-095	N (Et) C (0) CH ₂ Ph	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		178. 0-180. 0
30	1-095	T-25	Br	C (CF ₃) ₂ OH		209. 5-211. 0
	1-090	T-25	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		217. 0-217. 5
			CH ₃	CF (CF ₃) ₂		177. 0-179. 0
	1-098	N (Et) C (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		179. 0-181. 0
0.5	1-099	N (Et) C (0) OEt				102. 0-104. 0
35		N (Et) C (0) OEt	CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃		179. 0-180. 0
	1-101	N (Pr-n) C (0) 0Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		151. 0-153. 0
	1-102	N (Et) C (0) OCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		
	1-103	N (Et) C (0) OPh	CH3	CF (CF ₃) ₂		183. 0-184. 0
	1-104	N (Et) C (0) SPh	CH ₃	CF (CF ₃) ₂		224. 0-226. 0
40	1-105	N (Et) C (0) C (0) OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂		199. 0-201. 0
	1-106	N (Et) C (0) C (0) OEt	CH₃	$CF(CF_3)_2$		樹脂状
	1-107	N(Et) SCCl ₃	СНз	$CF(CF_3)_2$		195. 0-196. 0
	1-108	$N=C (CH_3) OCH_3$	СНз	CF (CF ₃) ₂		213. 0-214. 0
	1-109		F	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3		120. 0-141. 0
45	1-110	N=C (CH ₃) OEt	Br	OCF ₃		168. 0-170. 0
•	1-111	N=C (CH ₃) OEt	Br	C (CF ₃) ₂ OH		180. 0-182. 0
	1-112	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	Н		192. 0-194. 0
			Ū			

5	1-113 1-114 1-115 1-116 1-117 1-118 1-119 1-120	N=C (CH ₃) OE t N=C (CH ₃) OE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂ C (CF ₃) ₂ OH C (CF ₃) ₂ OCH ₃ OCF ₃ OCF ₂ Br OCF ₂ CHFC1 OCF ₂ CHFOCF ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	181. 0-182. 0 164. 0-166. 0 180. 0-181. 0 174. 0-175. 5 171. 0-171. 5 164. 0-166. 0 175. 0-176. 0 162. 0-164. 0
10	1-121 1-122 1-123 1-124 1-125 1-126	N=C (CH ₃) OE t N=C (Et) OE t N=C (Pr-n) OCH ₃	CH ₃ CH ₃ CF ₃ OCH ₃ CH ₃	O (L-45d) L-45d OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃ CF (CF ₃) ₂ CF (CF ₃) ₂	173. 0-174. 0 207. 0-209. 0 123. 0-126. 0 161. 0-162. 0 193. 0-194. 0 171. 0-174. 0
15 20	1-127 1-128 1-129 1-130 1-131 1-132	NHE t N (Et) C (0) CH ₃ N=C (CH ₃) OE t NHE t N (Et) C (0) CH ₃ N=C (CH ₃) OE t	CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃ CH ₃	0 (L-45c) 0 (L-45c) 0 (L-45c) L-45c L-45c L-45c	178. 0-180. 0 246. 0-248. 0 128. 0-130. 0 221. 0-223. 0 205. 0-207. 0 202. 0-203. 0

第8表

$$\begin{array}{c|c}
 & Y^1 \\
 & X^1 \\
 & Y^2 \\
 & C \\$$

25 —— No.	χ1	Υ1	ү2	m.p. (℃)
2-00	01 NHE t	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	245. 0-246. 0
	02 NHCHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	178. 0-180. 0
	03 N (CH ₃) CHO	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	191. 0-193. 0

第9表

$$\begin{array}{c|c}
Y^1 & 3 \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
& & & \\
&$$

5	No.	X1	Y 1	Y ²	(Y³) n	m.p. (℃)
อ	3-001	NHE t	H	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-CH ₃	95. 0-97. 0
	3-002	NHE t	СНз	OCF ₂ Br	3-C1	200. 0-202. 0
	3-003	NHE t	CH ₃	OCF ₂ Br	5-C1	180. 0-182. 0
	3-004	NHE t	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1	167. 0-168. 0
10	3-005	NHE t	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-CH ₃	192. 0-193. 0
	3-006	NHE t	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	5-C1	159. 0-161. 0
	3-007	NHE t	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3, 5-Cl ₂	176. 0-177. 0
	3-008	NHE t	СНз	0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂	213. 0-215. 0
	3-009	N (Et) C (0) CH ₃	H	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃	164. 0-168. 0
15	3-010	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCF ₂ Br	3-C1	110. 0-112. 0
	3-011	$N (Et) C (0) CH_3$	CH ₃	OCF ₂ Br	5-C1	93. 0-95. 0
	3-012	N (Et) C (0) CH ₃	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1	210. 0-212. 0
	3-013	N (Et) C (0) CH ₃	. CH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃	90. 0-92. 0
	3-014	N (Et) C (0) CH_3	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	5-C1	78. 0-80. 0
20	3-015	N (Et) C (0) CH_3	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3, 5-Cl ₂	94. 0-96. 0
	3-016	N (Et) C (0) CH_3	СНз	0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂	131. 0-133. 0
	3-017	N (Et) C (0) CH_3	СНз	Cl	5-0 (L-45d)	216. 0-218. 0
	3-018	$N=C (CH_3) OEt$	Н	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	3-CH ₃	150. 0-160. 0
	3-019	$N=C (CH_3) OEt$	CH ₃	OCF ₂ Br	3-C1	175. 0-176. 0
25	3-020	$N=C (CH_3) OEt$	СНз	OCF ₂ Br	5-C1	178. 0-180. 0
	3-021	$N=C (CH_3) OEt$	CH_3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1	164. 0-165. 0
	3-022	N=C (CH ₃) OEt	СНз	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-CH ₃	163. 0-165. 0
	3-023	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	5-C1	192. 0-193. 5
	3-024	N=C (CH ₃) OEt	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3, 5-Cl ₂	181. 0-182. 0
30	3-025	NHEt	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	6-CH ₃	185. 0-187. 0
	3-026	$N (Et) C (0) CH_3$	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	6-СН 3	97. 0-99. 0
	3-027	N=C (CH ₃) OEt	CH3	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	6-CH ₃	171. 0-173. 0

第10表

5	No.	X ¹ .	R ²	R ³	m.p. (℃)
J	4-001	3-NHE t	Н	Et	187. 0-189. 0
	4-002	3-NHE t	H	s-Bu	195. 0-197. 0
	4-003	3-NHE t	H	i-Bu	125. 0-128. 0
	4-004	3-NHE t	H	t-Bu	210. 0-212. 0
10	4-005	3-NHE t	H	c-Pen	樹脂状
	4-006	3-NHE t	H	c-Hex	195. 0-196. 0
	4-007	3-NHE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	151. 5-152. 5
	4-008	3-NHE t	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	103. 0-105. 0
	4-009	3-NHE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	118. 0-120. 0
15	4-010	3-NHE t	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	181. 0-183. 0
	4-011	3-NHOH	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	166. 0-168. 0
	4-012	3-N (Et) C (0) CH ₃	H	Et	104. 0-106. 0
	4-013	3-N (Et) C (0) CH ₃	Н	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	85. 0-87. 0
	4-014	3-N (Et) C (0) CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	89. 0-91. 0
20	4-015	3-N (Et) C (0) CH ₃	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	110. 0-112. 0
	4-016	3-N (Et) C (0) CH ₃	H	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	80. 0-81. 0
	4-017	3-N=CHOEt	H	t-Bu	186. 0-188. 0
	4-018	3-N=C (CH ₃) OE t	H	Et	162. 0-163. 0
	4-019	3-N=C (CH ₃) OE t	H	s-Bu	173. 0-175. 0
25	4-020	3-N=C (CH ₃) OE t	H	i-Bu	177. 0-179. 0
	4-021	3-N=C (CH ₃) OE t	H	t-Bu	173. 0-174. 0
	4-022	3-N=C (CH ₃) OE t	H	c-Pen	200. 0-201. 5
	4-023	3-N=C (CH ₃) OE t	H	c-Hex	210. 0-212. 0
	4-024	3-N=C (CH ₃) OE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	135. 0-136. 0
30	4-025	3-N=C (CH ₃) OE t	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	153. 0-155. 0
	4-026	3-N=C (CH ₃) OE t	H	CH (CH ₃) CH ₂ SCH ₃	165. 0-167. 0
	4-027	3-N=C (CH ₃) OE t	Н	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	96. 0-97. 0

第11表

	No.	R ³	R ⁵	Y 1	Y ²	m.p. (℃)
5	5-001	Et	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	167. 0-168. 0
	5-002	i-Pr	Н	СНз	CF (CF ₃) ₂	105. 0-107. 0
	5-003	i-Pr	CH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	153. 0-156. 0
	5-004	i-Pr	Et	F	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	158. 0-162. 0
	5-005	i-Pr	Et	Br	$C(CF_3)_2OH$	205. 0-206. 0
10	5-006	i-Pr	Et	Br	OCF ₃	53. 0-55. 0
	5-007	i-Pr	Et	СНз	H	165. 0-167. 0
	5-008	i-Pr	Et	СНз	CF (CF ₃) ₂	96. 0-98. 0
	5-009	i-Pr	Et	СНз	$C(CF_3)_2OH$	250. 0-251. 0
	5-010	i-Pr	Et	СНз	$C(CF_3)_2OCH_3$	90. 0-92. 0
15	5-011	i-Pr	Et	СНз	OCF ₃	91. 0-92. 0
	5-012	i-Pr	Et	СН₃	OCF ₂ Br	66. 0-68. 0
	5-013	i-Pr	Et	СНз	OCF ₂ CHF ₂	118. 0-120. 0
	5-014	i-Pr	Et	СНз	OCF ₂ CHFC1	80. 0-81. 0
	5-015	i-Pr	Et	СНз	OCF ₂ CF ₂ Br	174. 0-176. 0
20	5-016	i-Pr	Et	СНз	OCF ₂ CCl ₃	169. 0-171. 0
	5-017	i-Pr	Et	СНз	OCH (CF $_3$) $_2$	173. 0-175. 0
	5-018	i-Pr	Εt	СНз	OCF ₂ CHFCF ₃	80. 0-82. 0
	5-019	i-Pr	Et	CH 3	OCF ₂ CFBrCF ₃	170. 5-171. 5
	5-020	i-Pr	Et	СНз	OCF 2 CHFOCF 3	87. 0-89. 0
25	5-021	i-Pr	Et	СНз	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	67. 0-69. 0
	5-022	i-Pr	Et	СНз	0 (L-45d)	98. 0-99. 0
	5-023	i-Pr	· Et	СНз	L-45d	102. 0-104. 0
	5-024	i-Pr	Et	OCH ₃	OCF ₂ CHFOCF ₂ CF ₂ CF ₃	57. 0-59. 0
	5-025	i-Pr	Et	L-14t	CF ₃	213. 0-215. 0
30	5-026	i-Pr	n-Pr	СНз	CF (CF ₃) ₂	87. 0-89. 0
	5-027	i-Pr	i-Pr	СНз	CF (CF ₃) ₂	99. 0-102. 0
	5-028	i-Pr	n-Bu	СНз	CF (CF ₃) ₂	135. 0-137. 0
	5-029	i-Pr	c-Pen	СНз	CF (CF ₃) ₂	89. 0-91. 0
	5-030	i-Pr	CH ₂ OCH ₃	СНз	CF (CF ₃) ₂	107. 0-110. 0
35	5-031	i-Pr	CH ₂ OEt	CH3	CF (CF ₃) ₂	86. 0-89. 0
	5-032	i-Pr	CH ₂ SCH ₃	CH3	CF (CF ₃) ₂	98. 0-100. 0
	5-033	i-Pr	CH ₂ CH=CH ₂	СНз	CF (CF ₃) ₂	85. 0-87. 0
	5-034	i-Pr	$CH_2C \equiv CH$	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	91. 0-95. 0
					-	

					252	
	5-035	i-Pr	CH ₂ (L-1a)	СНз	CF (CF ₃) ₂	200. 0-201. 0
	5-036	i-Pr	C (0) CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	5-037	i-Pr	C (0) OCH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	109. 0-112. 0
	5-038	i-Pr	SO ₂ CH ₃	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	190. 0-192. 0
5	5-039	s-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	103. 5-106
	5-040	i-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	樹脂状
	5-041	t-Bu	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	87. 0-89. 0
	5-042	c-Pen	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	97. 0-99. 0
	5-043	c-Hex	Et	CH3	CF (CF ₃) ₂	117. 0-119. 0
10	5-044	CH (CH ₃) CH ₂ OCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	75. 0-77. 0
	5-045	CH2CH2SCH3	Et	CH3	CF (CF ₃) ₂	170. 0-171. 0
	5-046	C (CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Et	CH ₃	CF (CF ₃) ₂	63. 0-65. 0
	5-047	i-Pr	Et	CH ₃	0 (L-45c)	122. 0-124. 0
	5-048	i-Pr	Et	CH ₃	L-45c	138. 0-140. 0

PCT/JP02/07833

第12表

15

WO 03/011028

$$Et \xrightarrow{\mathbf{HN}} C \xrightarrow{\mathbf{C}} O \xrightarrow{\mathbf{C}} (\mathbf{Y}^3)_n^5$$

$$\mathbf{Et} \xrightarrow{\mathbf{N}} C \xrightarrow{\mathbf{CH}_3} C \xrightarrow{\mathbf{H}_3} C \xrightarrow{\mathbf{H}_3} C \xrightarrow{\mathbf{H}_3} C \xrightarrow{\mathbf{H}_3} C \xrightarrow{\mathbf{C}} C \xrightarrow{\mathbf{C}_3} C \xrightarrow{$$

20	No.	Y 1	ү2	(Y³) n	m. p. (℃)
	6-001	Н	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-CH ₃	91. 0-96. 0
	6-002	СНз	C1	5-0 (L-45d)	150. 0-152. 0
	6-003	СНз	OCF ₂ Br	3-C1	180. 0-182. 0
25	6-004	CH ₃	OCF ₂ Br	5-C1	162. 0-164. 0
	6-005	CH3	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-C1	85. 0-87. 0
	6-006	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3-CH ₃	78. 0-80. 0
	6-007	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	5-C1	148. 0-149. 0
	6-008	CH ₃	OCF 2 CHFOCF 2 CF 2 CF 3	3, 5-Cl ₂	91. 0-93. 0
30	6-009	CH ₃	0 (L-45d)	3, 5-Cl ₂	258. 0-260. 0
	6-010	CH3	$0CF_2CHFOCF_2CF_2CF_3$	6-СН ₃	80. 0-81. 0

第13表

RЗ R5 R 6 a No. R6 b Y¹ Y² m.p. (℃) 5 7-001 91. 0-93. 0 i-Pr Εt СНз CF (CF₃)₂ H СНз i-Pr 7-002 CF (CF₃)₂ Et Εt H CH₃ 樹脂状 7-003 i-Pr CF (CF₃)₂ Et n-Pr H CH₃ 樹脂状 CF (CF₃)₂ 7-004 i-Pr Et n-Bu H СНз 樹脂状 10 CF (CF₃)₂ 107. 0-109. 0 7-005 i-Pr Et Ph H CH₃

第14表

20

15 R^3 R^5 R6 a $R^{6\,b}$ No. Y¹ Y² m.p. (℃) 8-001 i-Pr Et H CF (CF₃)₂ 138. 0-140. 0 H CH3

[試験例]

次に、本発明化合物の有害生物防除剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

試験例1 ハスモンヨトウに対する殺虫試験

本発明化合物の10%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ(Spodoptera litura)の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、下記の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行なった。

死虫率 (%) = (死虫数/放虫数 $) \times 100$

その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明化合物: No. 1-003~007、1-009~014、1-017、1-018、1-020~024、1-026~028、1-031、1-032、1-034~036、1-039、1-040、1-042~051、1-054~056、1-057、1-064、1-067~069、1-074~078、1-080~083、1-086~091、1-093~095、1-098~108、1-111、1-113~117、1-119~121、1-125、1-126、3-012、3-014~016、3-021、4-002、4-004、4-007、4-009、4-010~012、4-013、4-016~019、4-021、4-024、4-026、4-027、5-001、5-003、5-008、5-010、5-020~022、5-026~028、5-031~033、5-034、5-035、5-039、5-041、5-044~046、6-005、6-007、6-009、7-001、7-002

25 試験例2 コナガに対する殺虫試験

30

本発明化合物の10%乳剤(化合物によっては25%水和剤を供試)を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ(Plutella xylostella)の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を調査し、試験例1と同様の計算式から死虫率を算出した。尚、試験は2区制で行なった。

その結果、下記の化合物が80%以上の死虫率を示した。

本発明化合物: No. $1-001\sim014$ 、 $1-017\sim070$ 、 $1-074\sim084$ 、 $1-086\sim091$ 、1-094、1-095、 $1-097\sim122$ 、 $1-125\sim129$ 、2-002、2-003、3-003、3-008、 $3-011\sim016$ 、3-020、 $4-001\sim027$ 、5-001、 $5-003\sim023$ 、 $5-026\sim047$ 、 $6-004\sim009$ 、 $7-001\sim05$ 、8-001

産業上の利用可能性

5

10

殺虫剤や殺菌剤の長年にわたる使用により、近年、病害虫が抵抗性を獲得し、従来の 殺虫剤や殺菌剤による防除が困難になっている。また、殺虫剤の一部には毒性の高いも の、長く環境中に残留するものが存在し、これらによる生態系の攪乱が問題となってい る。一方、本発明化合物は多くの農業害虫、ハダニ類に対して優れた殺虫・殺ダニ活性 を有し、既存の殺虫剤に対して抵抗性を獲得した害虫に対しても十分な防除効果を発揮 する。さらに、ホ乳類、魚類及び益虫に対してほとんど悪影響を及ぼさず、低残留性で 環境に対する負荷も軽い。

15 従って、本発明は有用な新規有害生物防除剤を提供することができる。

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 256

請 求 の範

1. 一般式(1):

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{2}$$

$$X^{2}$$

$$X^{3}$$

$$X^{4}$$

$$X^{1}$$

$$X^{2}$$

$$X^{3}$$

$$X^{4}$$

$$X^{5}$$

$$X^{7}$$

$$X^{7$$

式中、Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

Gは、G-1、G-2 又はG-3 を表し、 5

₩ 及び W は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

X'は、X'-1 又は X'-2 を表し、

$$-N^{5}$$
 $-N^{-5a}$
 $-N^{-5a}$
 $-N^{-1}$
 $-N^{-1}$
 $-N^{-1}$

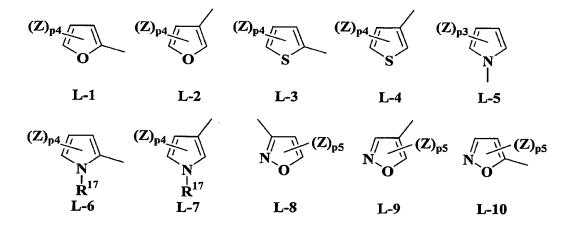
 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ ルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ 10 ルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、 mが2以上の整数を表すとき、各々の X^2 は互いに同一であっても、または相異なってい てもよく、

 Y^1 、 Y^2 及び Y^3 は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、 -SCN、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シク 15 ロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、

 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、-OH、 $-OR^8$ 、-SH、-S (O) $_2OR^{10}$ 、-S (O) $_2NHR^{11}$ 、-S (O) $_2N$ (R^{11}) R^{10} 、 $-NHR^9$ 、-N (R^9) R^8 、-CHO、<math>-C (O) R^{10} 、-C (O) OR^{10} 、-C (O) SR^{10} 、-C (O) NHR^{11} -C (O) N (R^{11}) R^{10} -C (S) OR^{10} -C (S) OR^{10} -C (S) OR^{10} -C (S) OR^{10} OR^{10} OR

更に Y¹、Y²及び Y³のうち、何れか 2 つの Y が隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N (R¹²) -, -CH₂N (R¹²) CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂OCH₂-, -CH₂OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂O-, -OC

Lは、式L-1から式L-58までの何れかで表される芳香族複素環を表し、



Mは、式M-1から式M-28までの何れかで表される脂肪族複素環を表し、

$$(R^{19})_{q4} \qquad (R^{19})_{q4} \qquad (R^{19})_{q3} \qquad (R^{19})_{q3$$

Z は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニルスはフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスはフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスはフェニルな表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスとなるなどに同じた。 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルズニルスとなるなどにのいるなど

 R^1 、 R^2 及び R^3 は、各々独立して水素原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_{12}$) アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された (R^{20}) R^{20} の R^{21} によって任意に置換された (R^{20}) R^{20} の R^{21} によって任意に置換された (R^{20}) R^{20} の R^{21} によって任意に置換された (R^{20}) R^{21} によって (R^{20})

15 -S (0) $_2$ N (R^{28}) R^{27} 、-N (R^{23}) R^{22} 、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) SR^{10} 、-C (0) N (R^{28}) R^{27} 、-C (S) OR^{10} 、-C (S) SR^{10} 又は M を表すか、或いは、 R^2 と R^3 とが一緒になって C_2 ~ C_6 アルキレ

ルを表し、

ン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3\sim7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル基又は $C_1\sim C_6$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

- R^4 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 R^{21} によって任意 に置換された $(C_1 \sim C_{10})$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルキュル・ $(C_2 \sim C_{10})$ アルキュー $(C_1 \sim C_{10})$ アル・ $(C_2 \sim C_{10})$ アル・ $(C_2 \sim C_{10})$ アル・(C
- 10 -C (0) N (R¹¹) R¹⁰、-C (0) C (0) OR¹⁰、-CH=NOR¹²、-C (R¹⁰) =NOR¹²、-P (0) (OR¹³) 2、-P (S) (OR¹³) 2、-P (フェニル)2、-P (フェニル)2、-P (D) (フェニル)2、(Z) p1 によって置換されていてもよいフェニル、(Z) p2 によって置換されていてもよいナフチル、(Z) p6 によって置換されていてもよいビフェニル、L 又は M を表し、p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R⁴ は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、
- R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキールカルボニルオキシ、 $-SR^{24}$ 、 $-S(0)_2R^{24}$ 、 $-SN(R^{26})$ R^{25} 、 $-S(0)_2N(R^{28})$ R^{27} 、-CHO、-C(0) R^{10} 、-C(0) OR^{10} 、-C(0) OR^{10} OR^{10}

 R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_3$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_3$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_3$) アルキル、($C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$) アルキル、 $C_2 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル又は ($C_1 \sim C_5$ アルケニル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル又は ($C_1 \sim C_5$ アルケニル・ $C_3 \sim C_5$ アルキニル又は ($C_1 \sim C_5$ アルケニル・ $C_3 \sim C_5$ アルキニル又は ($C_1 \sim C_5$ アルキニルフェニ

 R^{5b} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル又は $C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

 R^6 は、(i) A が炭素原子を表すとき、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置

換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(2)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 \mathbb{R}^5 と \mathbb{R}^6 とが一緒になって \mathbb{C}_2 $\sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

さらに或いは、 R^6 が R^2 と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) - 又は-C (O) C (R^{6a}) (R^{6b}) - を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する G 負又は G 負のヘテロ環を形成してもよいことを表し、

 $(i\ i)\ A$ が窒素原子を表すとき、 R^6 は R^2 と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) - 又は-C $(0)\ C$ (R^{6a}) (R^{6b}) - を形成することにより、G 及び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する G 負又は G 与のヘテロ環を形成することを表し、

R^{6a}及び R^{6b}は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、R²¹によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表すか、或いは、R^{6a} と R^{6b} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する炭素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキナメ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキナメ基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキナメ基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^7 は、ハロゲン原子、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ ハロシクロアルキル、-OH、

25 $-OR^8$ 、-ON=C (R^{11}) R^{10} 、-SH、-S (O) ${}_{r}R^8$ 、 $-NHR^9$ 、-N (R^9) R^8 、 $C_1\sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、-Si (R^{15}) (R^{16}) R^{14} 、(Z) ${}_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、(Z) ${}_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、

 R^8 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_1\sim C_6)$ アルキル、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3\sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 R^{30}

によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 R^{10} 、-C (0) R^{10} 、-C (0) (0) R^{10} 、-C (0)

5

10

15

 R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~7 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル基によって置換されていてもよく、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス トルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルス ルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シア ノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、トリメチルシリル($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、トリメチルシリル($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルナル、 $C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_1 \sim C_4$)フェルキール、($C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニー($C_3 \sim C_6$ ハロアルキニー(

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 264

又は M を表し、

25

 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_6)$ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 C_3 ~C₆ アルキニル又は C₃~C₆ ハロアルキニルを表すか、或いは、R¹⁰ と R¹¹ とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成し てもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる .1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基 又は(Z)。によって置換されていてもよいフェニル基によって置換されていてもよく、

10 \mathbb{R}^{12} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ C_a) P \mathcal{N} + \mathcal{N} , $C_1 \sim C_4$ P \mathcal{N} - $\mathcal{$ ニル (C₁~C₂) アルキル、C₁~C₂ アルコキシカルボニル (C₁~C₂) アルキル、ジ (C₁~C₂ アルキ \mathcal{L} \mathcal{L} $\sim C_4$) アルキル、L- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、M- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ 15 ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 C_3 ~C₆ハロアルキニル又は(Z),によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 \mathbb{R}^{14} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は $(\mathbb{Z})_{n_1}$ によって置換されていてもよい 20 フェニルを表し、

 R^{15} 及び R^{16} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 \mathbb{R}^{17} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{p_1}$ によって置 換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニ ル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカ ルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル又は $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよい フェニルを表し、

 \mathbb{R}^{18} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$

10

15

20

 R^{19} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) なる。 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルでは、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルでは、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル又は($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$) によって置換されていてもよいフェニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは($C_1 \sim C_6$) によって

 R^{20} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル アミノチオカルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルボニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルスルボニー

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、-OH、-OH、-OH、-OH、-OH0 -OH1 -OH1 -OH2 -OH2 -OH3 -OH4 -OH5 -OH6 -OH7 -OH8 -OH7 -OH8 -OH9 -OH9

25 $-P(0)(0R^{13})_2$ 、 $-P(S)(0R^{13})_2$ 、 $-P(Dx=D)_2$ 、 $-P(0)(Dx=D)_2$ 、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、 R^{22} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1\sim C_4)$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ アルケニル、 $C_3\sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3\sim C_6$ アルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

PCT/JP02/07833 WO 03/011028 266

 R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアル キルカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_8$ ハロアルコキシカルボニル、 $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよいフェニル(C₁~C₂)アルコキシカルボニル、(Z), によって置 換されていてもよいフェノキシカルボニル又は(Z)。によって置換されていてもよいフェ ニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルケニ ル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置 換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

 \mathbb{R}^{25} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$) アルキル、 10 $C_2 \sim C_{12}$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_{12})$ アルキル、 $(Z)_{11}$ によって 置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケ ニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニル又は(Z)。によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ ($C_1 \sim C_{12}$) アルキル、 15 置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルケ ニル、 $C_3 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ ハロアルキニル又は $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよ いフェニルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成する ことにより、結合する窒素原子と共に5~8員環を形成してもよいことを表し、このと

きこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、

且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{27} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ C_6 シアノアルキル、 $(Z)_{nl}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6 P \mathcal{N} + \mathcal{$ \sim C₈ハロアルコキシ、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジルオキシ又は(Z) $_{p1}$ に よって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{28} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって C₂~C₇アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に 5~8員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫

黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシ基によって任意に置換されていてもよく、

PCT/JP02/07833

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキルチオ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキルチュ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキューロ、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキューロ、(C

 R^{30} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3\sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_8$ ハロシクロアルキル、-OH、 $-OR^{32}$ 、-SH、-S (O) $_{r}R^{32}$ 、 $-NHR^{33}$ 、-N (R^{33}) R^{32} 、-CHO、-C (O) R^{34} 、-C (O) OH、-C (O) OR^{34} 、-C (R^{34}) $=NOR^{12}$ 、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、(Z) $_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、(Z) $_{p3}$ によって置換されていてもよいナフチル、(Z) $_{p3}$ によって置換されていてもよいナフチル、(Z) $_{p3}$ によって置換されていてもよいナフチル、(Z) $_{p3}$ によって置換されていてもよい

10

15 \mathbb{R}^{31} は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ ハロシクロアル キル、-OH、-OR³²、-SH、-S (0) _rR³²、-NHR³³、-N (R³³) R³²、-CHO、-C (0) R¹⁰、-C (0) OR¹⁰、 -C (0) SR^{10} , -C (0) NHR^{11} , -C (0) N (R^{11}) R^{10} , -C (0) C (0) OR^{10} , $-CH=NOR^{12}$, -C (R^{10}) $=NOR^{12}$, -P (0) $(0R^{13})_2$ 、-P (S) $(0R^{13})_2$ 、-P (フェニル) $_2$ 、-P (0) (フェニル) $_2$ 、 $(Z)_{pi}$ によって置換され ていてもよいフェニル、 $(Z)_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、L 又は M を表し、 \mathbb{R}^{32} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ 20 C_6 アルキルチオ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキ ニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカ ルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アル 25 キルアミノカルボニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル、(Z) $_{n1}$ によって置換され ていてもよいフェニルカルボニル、C1~C6アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C1~C6ア ルキル)アミノチオカルボニル、(Z) ni によって置換されていてもよいフェニル、(Z) n2 に

よって置換されていてもよいナフチル、L又はMを表し、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

 R^{33} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_6 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキレンがを表すか、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキレンがを形成することにより、結合する窒素原子と共に3 ~ 6 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子又はメチル基によって置換されていてもよく、

 R^{34} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、(Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルナニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、(C) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、(C) $_{p2}$ によって置換されていてもよいナフチル、 $C_2 \sim C_6$ アルキスト

mは、1~3の整数を表し、

nは、1~3の整数を表し、

pは、1~6の整数を表し、

20 p1は、1~5の整数を表し、

5

10

15

p2 は、1~7の整数を表し、

p3 は、1~4の整数を表し、

p4 は、1~3の整数を表し、

p5 は、1~2の整数を表し、

25 p6は、1~9の整数を表し、

a1 は、 $0 \sim 3$ の整数を表し、

a2 は、 $0 \sim 5$ の整数を表し、

a3 は、 $0 \sim 7$ の整数を表し、

04 は、0~9の整数を表し、

rは、 $0 \sim 2$ の整数を表す、

れていてもよく、

で表される置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

269

- 2. 請求の範囲第1項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種 以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。
 - 3. 請求の範囲第1項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。
 - 4. 請求の範囲第1項記載の一般式(1)で表される化合物において、Aは、炭素原子を表し、
- Y¹、Y²及びY³は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、アジド、-10 SCN、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シク ロアルキル、R⁷によって任意に置換された(C₃~C₆)シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、 \mathbb{R}^7 によって任意に置換された ($\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$) アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ ハロ シクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 -OH, $-OR^8$, -SH, -S(0), R^8 , -S(0), OR^{10} , -S(0), NHR^{11} , -S(0), $N(R^{11})$, R^{10} , $-NHR^9$, $-N(R^9)$, R^8 , $-N(R^9)$, -CHO, $-C(0)R^{10}$, $-C(0)OR^{10}$, $-C(0)SR^{10}$, $-C(0)NHR^{11}$, $-C(0)N(R^{11})R^{10}$, $-C(S)OR^{10}$, $-C(S)SR^{10}$, -C (S) NHR¹¹, -C (S) N (R¹¹) R¹⁰, $-CH=NOR^{12}$, -C (R¹⁰) $=NOR^{12}$, -C ($=NOR^{12}$) OR^{10} , -C ($=NOR^{10}$) OR^{10} , -C ($=NOR^{10}$) OR^{10} , -C (=N $-C = NOR^{12} NH (R^{11}), -C = NOR^{12} N (R^{11}) R^{10}, -P (0) (0R^{13})_2, -P (S) (0R^{13})_2, -P (0) (R^{14}) (0R^{13}),$ -Si (R¹⁵) (R¹⁶) R¹⁴、(Z) pl によって置換されていてもよいフェニル、(Z) pl によって置換され ていてもよいナフチル、L-1~L-13、L-15~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、n が 2 以上 20 の整数を表すとき、各々のYは互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、 更に、nが2以上の整数であり、且つ2つのYが隣接する場合には、隣接する2つのY lt-CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂N (R¹⁷) -, $-CH_{2}N\ (R^{17})\ CH_{2}-,\quad -CH_{2}CH_{2}CH_{2}CH_{2}-,\quad -CH_{2}CH_{2}CH_{2}O-,\quad -CH_{2}CH_{2}OCH_{2}-,\quad -CH_{2}OCH_{2}O-,\quad -CH_{2}CH_{2}O-,\quad -CH_{2}CH_$ -CH₂CH=CH-, -OCH=CH-, -SCH=CH-, -N (R¹⁷) CH=CH-, -OCH=N-, -SCH=N-, -N (R¹⁷) CH=N-, 25 -N (R¹⁷) N=CH-. -CH=CHCH=CH-, -OCH,CH=CH-, -N=CHCH=CH-又は-N=CHN=CH-を形成すること により、それぞれのYが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、 このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は R18 によって任意に置換さ

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキール、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキールカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルスは $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよい置換アミド化合物又はその塩。

10 5. 請求の範囲第1項記載の一般式(1)で表される化合物において、

Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

Gは、G-1を表し、

X¹は、X¹-1を表し、

 R^2 は R^6 と一緒になって-C (R^{6a}) (R^{6b}) -又は-C (0) C (R^{6a}) (R^{6b}) -を形成することにより、G 及 び X^1 が結合するベンゼン環と縮合する G 員又は G 負のヘテロ環を形成することを表す置 換アミド化合物又はその塩。

6. 一般式(2):

20

$$(X^{2})_{\overline{m-1}} \xrightarrow{P} G$$

$$(Y^{1})_{\overline{N}} \xrightarrow{(Y^{3})_{n}} (Y^{3})_{n} \qquad (2)$$

式中、Gは、G-1又はG-2を表し、

$$-\frac{W^{2}}{C}$$

$$N-R^{3}$$

$$R^{2}$$

$$G-1$$

$$W^{2}$$

$$R^{4})_{p3}$$

$$R^{2}$$

W 及び W は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833 271

X¹は、X¹-1 又は X¹-2 を表し、

10

$$-N$$
 R^{6}
 $-N = C$
 R^{5a}
 $X^{1}-1$
 $X^{1}-2$

 X^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim$ C₁~C₆アルキルスルホニル又はC₁~C₆ハロアルキルスルホニルを表し、mが2以上の整数 を表すとき、各々の X2 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ ル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコ キシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル・ $(C_1 \sim$ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim$ $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキ ルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ、 $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、C₁~C₆ハロ アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、C₁~C₆ハロアルキルスルホニル、C₁ $\sim C_6 T \mathcal{N} + \mathcal{N} T = \mathcal{N} \cdot \mathcal{N}$

-Si (R¹⁵) (R¹⁶) R¹⁴、(Z) n によって置換されていてもよいフェニル、L-1~L-13、L-15~L-35、 L-37~L-51、M-1、M-6、M-10、M-23 又はM-26 を表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 \mathbb{R}^7 によって 任意に置換された $(C_1 \sim C_s)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 \mathbb{R}^7 によって任意に置換され た $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 \mathbb{R}^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アル 20 ケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 \mathbb{R}^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_8) \ \mathcal{F} \mathcal{V} + \mathcal{I} \mathcal{V}, -OR^{8a}, -S(0) R^{8a}, -S(0) OR^{10}, -S(0) R^{11} R^{10}, -N(R^9) R^{8b},$ -C (0) R^{10} , -C (0) OR^{10} , -C (0) N (R^{11}) R^{10} , $-CH=NOR^{12}$, -C (R^{10}) $=NOR^{12}$, -P (0) (OR^{13}) $_{2}$, -P (S) $(0R^{13})_2$ 、 $-Si(R^{15})(R^{16})R^{14}$ 、(Z) $_{D1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $L-1\sim L-13$ 、 25 L-15~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、

 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ

10

15

20

ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、-0- (L-17)、-0- (L-45)、

-0-(L-48)、 $C_1\sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1\sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、 $L-1\sim L-13$ 、 $L-15\sim L-35$ 、 $L-37\sim L-51$ 、M-1、M-6、M-10、M-23 又は M-26 を表し、n が 2 又は 3 を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なっていてもよく、

さらに、 Y^3 が Y^1 又は Y^2 と隣接する場合には、隣接する 2 つの Y^1 と Y^3 又は Y^2 と Y^3 は $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2-$, $-CH_2$

-0CH₂CH₂S-, -0CH=N-, -SCH=N-又は-N(R¹⁷)CH=N-を形成することにより、それぞれのY¹及びY³又はY²及びY³が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はR¹⁸によって任意に置換されていてもよく、

 R^1 及び R^2 は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルケニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルナニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_3 \sim C_6)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニル又は $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8 P N$ キル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8) P N$ キル、 $C_3 \sim C_8$ シクロ P Nキル、E F D キシ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N D$ オン $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N D$ オルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N D$ オルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4 P N D$ オルスルカニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6 P N D$ カロアルキル、 $(C_3 \sim C_8) P N D$ カロアルケニル、 $(C_3 \sim C_8) P N D$ カロアルケニル、 $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_3 \sim C_8) P N D$ カロアルケニル、 $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_3 \sim C_8) P N D$ オニル、 $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_3 \sim C_8) P N D$ オニル、 $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_3 \sim C_8) P N D$ オニル、 $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(D_1)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(D_2)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(D_3)_{p1}$ によって $(D_3)_{p1}$ によって

WO 03/011028

10

15

20

のアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 C_3 $\sim C_6$ シクロアルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_{10})$ アルキニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p6}$ によって置換されていてもよいビフェニル、 $(Z)_{p6}$ によってであっても、または相異なっていてもよく、

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($Z_1 \sim Z_4$) アルキル、($Z_2 \sim Z_6$) アルキル、($Z_1 \sim Z_4$) アルキル、 $Z_1 \sim Z_6$ アルキル)アミノカルボニル($Z_1 \sim Z_4$) アルキル、ジ($Z_1 \sim Z_6$ アルキル)アミノカルボニル($Z_1 \sim Z_4$) アルキル、($Z_1 \sim Z_4$) アルキル、 $Z_2 \sim Z_6$ アルキル)、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキル、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキル、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキル、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキル、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキール、 $Z_3 \sim Z_6$ アルキール・ $Z_3 \sim Z_6$

 R^{5a} は、水素原子、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、 $C_1 \sim C_5$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ アルケニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

R^{5b}は、C₁~C₈アルキルを表し、

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキールカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^5 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 負環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つハロゲン原子、酸素原子又はメチル基によって任意に置換されて

いてもよく、

20

 R^7 は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニ ルオキシ、Cゥ~Cゥハロアルケニルオキシ、Cゥ~Cゥアルキニルオキシ、Cゥ~Cゥハロアルキニ ルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカル ボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコ + ≥ \times , -0N=C (R¹¹) R¹⁰, -0- (L-18) \times -0- (L-21) \times -0- (L-25) \times -0- (L-45) \times -0- (L-48) \times -0-(L-49), $C_1 \sim C_6 P \mathcal{V} + \mathcal{V} +$ $C_1 \sim C_6 \land D_7 \lor D_7 \lor D_7 \lor D_7 \lor D_8 \lor D_8$ ホニル、(乙)。によって置換されていてもよいフェニル又は L を表し、

 R^{8a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロ 10 アルキル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 \mathbb{R}^{30} によって任意に置 換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、-S(0) $_2$ R¹⁰、-P(0)(0R¹³) $_2$ 、 -P(S)(OR¹³)₂、(Z)_{a1}によって置換されていてもよいフェニル、L-17、L-18、L-21、L-25、 L-45、L-48 又は L-49 を表し、 15

R^{8b}は、-C(0)R¹⁰又は-C(0)OR¹⁰を表し、

 R^9 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル表し、

 \mathbb{R}^{10} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6 P \mathcal{N}$ $= 1 + 2 \cdot (C_1 \sim C_4) P \mathcal{N} + \mathcal{N} \cdot C_1 \sim C_6 P \mathcal{N} + \mathcal{N} + \mathcal{N} \cdot C_1 \sim C_4 P \mathcal{N} + \mathcal{N} \cdot C_1 \sim C_6 P \mathcal{N} + \mathcal{N} \cdot C_1$ ルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル $(C_1 \sim C_6)$ C_4) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、(Z) $_{11}$ によって置換されてい てもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル $(C_3 \sim C_8)$ シ クロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ ハロアルケニル ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、(Z)」によって置換されていてもよいフェニル、L又はMを表し、

 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを表 25 すか、或いは、R¹⁰とR¹¹とが一緒になってC₂~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結 合する窒素原子と共に3~6員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレ ン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる1個の原子を含んでもよく、且つ C₁~C₆アル キル基又は C₁~C₆アルコキシ基によって置換されていてもよく、

15

25

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_2 \sim C_4$) アルキル、 ($C_3 \sim C_6$ アルキル、 ($C_3 \sim C_6$ アルキールを表し、 $C_3 \sim C_6$ アルキルを表し、 $C_3 \sim C_6$ アルキルを表し、

 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルカコィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルスは $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に2個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (0) $_rR^{29}$ 、-N (R^9) R^{8c} 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C $(R^{10})=NOR^{12}$ 、(Z) $_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_6$ ($C_4 \sim C_4 \sim C_6$) $C_4 \sim C_6$ ($C_4 \sim C_6 \sim C_6$) $C_5 \sim C_8 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8 \sim C_8 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_5 \sim C_8 \sim$

置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{22} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4)$ アルキルを表し、

 R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルコキシカルボニ

15

20

ル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシカルボニル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

5 R^{25} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル又は $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシカルボニルを表し、

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{27} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ シアノアルキル、(\mathbb{Z}) \mathbb{C}_1 によって置換されていてもよいベンジル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルケニル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル又は (\mathbb{Z}) \mathbb{C}_1 によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって C_4 $\sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5\sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された (R^{31}) シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された (R^{31}) シクロアルキニル、 R^{31} によって置換されていてもよいフェニルチオ、 R^{31} によって置換されていてもよいフェニルチオ、 R^{31} によって置換されていてもよいフェニルチオ、 R^{31} によって置換されていてもよいフェニルチオ、 R^{31} によって

25 -C (S) N (R¹¹) R¹⁰、-P (0) (OR¹³) ₂、-P (S) (OR¹³) ₂、(Z) _{p1} によって置換されていてもよいフェニ ル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 \mathbb{R}^{30} は、ハロゲン原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルコキシ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキンチオ又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキルチオ又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキルチオスは $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ

よって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $-OR^{32}$ 、-S (0) ${}_{r}R^{32}$ 、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 又は (Z) ${}_{r}$ 1 によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{32} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルカルボニル又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

mは、 $1 \sim 3$ の整数を表し、

nは、1~3の整数を表し、

pは、1~4の整数を表す、

10 で表される請求の範囲第4項記載の置換アミド化合物又はその塩。

7. 一般式(3):

$$\begin{array}{c}
Y^{1} \\
X^{1} \\
X^{1} \\
X^{2} \\
X^{3} \\
X^{5} \\
X^{5} \\
X^{6b}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
Y^{1} \\
X^{2} \\
Y^{3} \\
Y^{3} \\
Y^{3} \\
Y^{3} \\
Y^{3} \\
Y^{4} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6a} \\
Y^{6b}$$

$$\begin{array}{c}
X^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6a} \\
Y^{6b}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
X^{2} \\
Y^{3} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6b}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
X^{2} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6a} \\
Y^{6b}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
X^{2} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{5} \\
Y^{6a} \\
Y^{6b}
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
X^{2} \\
Y^{5} \\$$

式中、Aは、炭素原子又は窒素原子を表し、

WI 及び WI は、各々独立して酸素原子又は硫黄原子を表し、

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、m が 2 以上の整数を表すとき、各々の Y^2 は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ 20 ル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_4)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_4)$ アルキル・ $(C_3 \sim C_4)$

 C_8 シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルチオ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルチオ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル・ $(Z)_{p1}$ によい

 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^7 によって10 任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^7 によって任意に置換された $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^7 によって任意に置換された $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル、 $-OR^{8a}$ 、-S(0) $_rR^{8a}$ 、-S(0) $_2OR^{10}$ 、-S(0) $_2N(R^{11})$ R^{10} 、 $-N(R^9)$ R^{8b} 、-C(0) R^{10} 、-C(0) OR^{10} 、-C(0) $N(R^{11})$ R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、 $-C(R^{10})=NOR^{12}$ 、-P(0) (OR^{13}) $_2$ 、-P(0) (OR^{13}) $_2$ 、-P(0) (OR^{13}) $_2$ -P(0) (OR^{13}) $_2$ -P(0) (OR^{13}) $_2$ -P(0) (OR^{13}) $_2$ -P(0) (OR^{14}) -P(0) (OR^{15}) -P(0) -P(0)

-0CH $_2$ CH $_2$ S $^-$ 、-0CH $^-$ N $^-$ 、-SCH $^-$ N $^-$ N $^-$ CH $^-$ N $^-$ N (\mathbb{R}^{17}) CH $^-$ N $^-$ を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は \mathbb{R}^{18} によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^1 は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アル キル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $(Z)_{11}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスル ホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ ア ルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアル キニル、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、-SR²⁴、-S (0) $_2$ R²⁴、-SN (R^{26}) R^{25} 、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニ ル又は C₁~C₆ アルコキシカルボニルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロ アルキル、ヒドロキシ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロ 10 アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_3 \sim C_6)$ アルケニル、L- $(C_3 \sim C_6)$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $(Z)_{n1}$ によって置換され ていてもよいフェニル ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、L- ($C_3 \sim C_6$) アルキニル、- OR^{22} 、- $N(R^{23})$ R^{22} 、L 又は M を表すか、或いは、 \mathbb{R}^2 と \mathbb{R}^3 とが一緒になって $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ アルキレン鎖を形成すること 15 により、結合する窒素原子と共に3~7員環を形成してもよいことを表し、このときこ のアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる1個の原子を含んでも よく、且つハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されて いてもよく、

 \mathbb{R}^5 は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ シクロアルキル ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 20 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{01}$ によって 置換されていてもよいフェニルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア ルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニ \mathcal{N} ($\mathcal{C}_1 \sim \mathcal{C}_4$) アルキル、(\mathcal{Z}) $_{\mathbf{n}}$ によって置換されていてもよいフェニル($\mathcal{C}_1 \sim \mathcal{C}_4$) アルキル、 \mathcal{L} -25 $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $M-(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル・ $C_5 \sim C_6$ アルケーク $C_6 \sim C_6$ アルケーク C_6 C_6 ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカル ボニルオキシ、-SR²⁴、-S (0) ₂R²⁴、-SN (R²⁶) R²⁵、-S (0) ₂N (R²⁸) R²⁷、-CHO、-C (0) R¹⁰、-C (0) OR¹⁰、 -C (0) SR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、-C (0) C (0) OR^{10} 、-C (S) OR^{10} 、-C (S) SR^{10} 、-C (S) N (R^{11}) R^{10} 又は

15

20

25

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

(2)」によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_5 \sim C_6$ シクロアルキル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルカール、 $C_2 \sim C_6$ アルカール・ $C_$

 R^{8a} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルケニル、 R^{30} によって任意に置換された ($C_2 \sim C_6$) アルキニル、 R^{30} によって任意に置換された (R^{30} によって置換されていてもよいフェニル、 R^{30} によって

R^{8b}は、-C(0) R¹⁰又は-C(0) OR¹⁰を表し、

R⁹は、水素原子、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキル表し、

 R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル($C_3 \sim C_8$)シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、($C_2 \sim C_6$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルケニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_8$ アルキニル・ $C_3 \sim C_8$ アルキュール・ $C_3 \sim C_8$ アルキニル・ $C_3 \sim C_8$ アルキュール・ $C_3 \sim C_8$ アルキュート

 R^{11} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって $C_2 \sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシ基によって置換されていてもよく、

 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル) アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_2 \sim C_6$ アルケニル、 ($C_3 \sim C_6$ アルケニル又は ($C_3 \sim C_6$ アルキニルを表し、

20 R^{13} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル又は $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルスは $(Z)_{pi}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に 2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっ

ていてもよく、

25

 R^{21} は、ハロゲン原子、シアノ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、-OH、 $-OR^{8c}$ 、-SH、-S (0) $_rR^{29}$ 、-N (R^9) R^{8c} 、-CHO、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C (R^{10}) $=NOR^{12}$ 、 (Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{8c} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル・ $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル・ $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル・ $C_3 \sim C_8$ シクロアル・ $C_4 \sim C_8$ シクロアル・

-C (0) $0R^{10}$, -C (0) N (R^{11}) R^{10} , -C (S) N (R^{11}) R^{10} , -S (0) ${}_{2}R^{10}$, -S (0) ${}_{2}N$ (R^{11}) R^{10} , -P (0) ($0R^{13}$) ${}_{2}$,

10 -P(S)(OR¹³)₂又は(Z)_{p1}によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{22} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{\mathfrak{p}_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4)$ アルキルを表し、

 \mathbb{R}^{23} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $-\mathbb{C}HO$ 、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニルでは $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニルでもよいフェニルカルボニルを表し、

 \mathbb{R}^{24} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は \mathbb{C}_{0,p_1} によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{25} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシカルボニル ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル又は $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_{12}$ アル 20 コキシカルボニルを表し、

 R^{26} は、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキルを表すか、或いは、 R^{25} と R^{26} とが一緒になって $C_4 \sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ C_1 $\sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{27} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_2 \sim \mathbb{C}_6$ シアノアルキル、 (\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ シクロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_6$ アルキニル又は (\mathbb{Z}) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

 R^{28} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{27} と R^{28} とが一緒になって C_4 $\sim C_7$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $5 \sim 8$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_4$ アルキル基によって任意に置換されていてもよく、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_8$) アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_3 \sim C_8$) シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 (Z_{10} によって置換されていてもよいフェニルチオ、 Z_{10} - Z_{10} - Z_{10} (Z_{10}) $Z_{$

-C (S) N (R⁽¹⁾) R⁽¹⁾、-P (0) (OR⁽¹⁾)₂、-P (S) (OR⁽¹⁾)₂、(Z)_{p1} によって置換されていてもよいフェニル、L-18、L-21、L-25、L-30、L-31、L-32、L-33、L-34、L-35、L-37、L-38、L-40、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{30} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $-OR^{32}$ 、-S (0) ${}_{r}R^{32}$ 、-C (0) R^{10} 、-C (0) OR^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 又は (Z) ${}_{r}$ 1 によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 R^{32} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニルを表し、

mは、1~3の整数を表し、

5

20

nは、1~5の整数を表し、

0は、0又は1の整数を表す、

で表される請求の範囲第5項記載の置換アミド化合物又はその塩。

25 8. ₩ 及び ₩ は、酸素原子を表し、

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はトリフルオロメタンスルホニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の X² は互いに

10

15

20

25

同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

Y²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、-SF₅、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6 P N + N + T (C_1 \sim C_4) P N + N C_1 \sim C_6 N D P N + N + T (C_1 \sim C_4) P N + N C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ヒドロキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 C_1 $\sim C_6$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $(Z)_{ij}$ によって置換されて いてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア ルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキシ $(C_1 \sim C_4)$ C_4) ハロアルコキシ、 $(Z)_{n1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルコキ $v \in C_3 \sim C_8 \cap V$ $(C_2 \sim C_0)$ $\wedge \Box P \mathcal{V} = \mathcal{V} + \mathcal$ $\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{ij}$ によって置 換されていてもよいフェノキシ、-0-(L-17)、-0-(L-45)、-0-(L-48)、-0-(L-49)、 $_1$ ~ $_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルチオ、 $(Z)_{01}$ によって置換 されていてもよいフェニルチオ、-S-(L-17)、-S-(L-45)、-S-(L-48)、-S-(L-49)、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルス ルホニル、C₂~C₆ハロアルケニルスルホニル、-N (R⁹) R^{8b}、-Si (CH₃) ₃R¹⁴、L-1~L-13、L-15 ~L-35、L-37~L-58 又は M を表し、

 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ

ル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルを表し、 $C_1 \sim C_6$ か2又は3を表すとき、各々の Y^3 は互いに同一であっても、又は相異なっていてもよく、

5 さらに、Y³がY¹又はY²と隣接する場合には、隣接する2つのY¹とY³又はY²とY³は -CH₂CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -OCH₂O-, -CH₂CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -CH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH₂CH₂S-, -OCH=N-, -SCH=N-又は-N(R¹7)CH=N-を形成すること により、それぞれのY¹及びY³又はY²及びY³が結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素 の子はR¹8によって任意に置換されていてもよく、

R'は、水素原子を表し、

15

20

R²は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキュー $(C_1 \sim C_8)$

 R^4 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_6)$ アルキルを 表し、p が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^4 は互いに同一であっても、または相異 なっていてもよく、

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 ($C_1 \sim C_4$) アルキル・ (C_1

10

 R^6 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-CHO、 $C_1 \sim C_4$ アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニルを表すか、或いは、 R^6 と R^6 とが一緒になって $C_2 \sim C_6$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 7$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子、硫黄原子及び窒素原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ酸素原子又はメチル基によって任意に置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{14} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は $(\mathbb{Z})_{11}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

15 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 R^{18} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、同時に2 個以上の R^{18} で置換されている場合、各々の R^{18} は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

R²¹は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₆シクロアルキル、-OH、-OR^{8c}、-SH、-S (0) , R²⁹、

20 -N (R^9) R^{8c} 、-CHO、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、(Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、-C (O) N (R^{11}) R^{10} 、 $-CH=NOR^{12}$ 、-C (R^{10}) $=NOR^{12}$ 、(Z) $_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 \mathbb{R}^{8c} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$)

25 PV+VV, $-C(0)R^{10}$, $-C(0)OR^{10}$, $-C(0)N(R^{11})R^{10}$, $-C(S)N(R^{11})R^{10}$, $-S(0)_{2}R^{10}$,

-S (0) $_2$ N (R^{11}) R^{10} 、-P (0) ($0R^{13}$) $_2$ 、-P (S) ($0R^{13}$) $_2$ 又は (Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表し、

 \mathbb{R}^{10} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキルチオ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$)

C₆アルケニルを表し、

5

15

20

アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L 又は M を表し、

 R^{11} は、水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表すか、或いは、 R^{10} と R^{11} とが一緒になって C_2 $\sim C_5$ アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に $3 \sim 6$ 員環を形成してもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1 個の原子を含んでもよく、且つ $C_1 \sim C_6$ アルキル基によって置換されていてもよく、 R^{12} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、ジ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)アミノカルボニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキルスは $C_3 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキルスは $C_3 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキルスは $C_3 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル (C_1

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 (Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、 -C (0) R^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、-C (S) N (R^{11}) R^{10} 、 (Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45 、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $O_1 \sim O_2$ アルキルカルボニル、 $O_2 \sim O_3$ アルキルアミノカルボニル、 $O_3 \sim O_4$ で表す請求の範囲第6項記載の置換アミド化合物又はその塩。

9. ₩1及び ₩2は、酸素原子を表し、

X²は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メ 25 トキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、メ チルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メタンスルホニル又はト リフルオロメタンスルホニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の X²は互いに 同一であっても、または相異なっていてもよく、

 Y^1 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 (Z) $_{p1}$

によって置換されていてもよいベンジル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシ、 $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェノキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ又は $(Z)_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニルチオを表し、

5 Y^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $-SF_5$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 アルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル ($C_1 \sim C_4$) アルキ ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル ($C_1 \sim C_4$) 10 アルキル、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 C_1 $\sim C_6$ $\wedge C_7 \sim C_6$ $\wedge C_7 \sim C_6$ $\wedge C_7 \sim C_6$ $\wedge C_7 \sim C_8$ $\wedge C_7 \sim C_8 \sim C_8$ $\wedge C_7 \sim C_8 \sim$ $C_2 \sim C_6 \land \Box P \lor C_1 \sim C_4) \land \Box P \lor C_3 \sim C_6 \land C_6 \land C_7 \lor C_7 \sim C_8) \land \Box$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシ $(C_1 \sim C_4)$ ハロアルキル、 $(Z)_{pl}$ によって置換されて いてもよいベンジルオキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ア ルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロ 15 アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) ハロアルコキシ ($C_1 \sim C_4$) C₄) ハロアルコキシ、(Z) n によって置換されていてもよいフェニル (C₁~C₄) ハロアルコキ シ、 $C_3 \sim C_8$ ハロシクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $(C_2 \sim C_6)$ $\wedge \Box P \mathcal{V} = \mathcal{V} + \mathcal$ 20 $\sim C_6$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $(Z)_{s1}$ によって置 換されていてもよいフェノキシ、-0-(L-17)、-0-(L-45)、-0-(L-48)、-0-(L-49)、C1~C6 アルキルチオ、C₁~C₆ハロアルキルチオ、C₂~C₆ハロアルケニルチオ、(Z)₁によって置換 されていてもよいフェニルチオ、-S-(L-17)、-S-(L-45)、-S-(L-48)、-S-(L-49)、C1~C6 ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルス 25 ルホニル、C₂~C₆ハロアルケニルスルホニル、-N (R⁹) R⁸⁶、-Si (CH₂), R¹⁴、L 又は M を表し、 Y^3 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキ $\mathcal{L}_1 \sim \mathcal{L}_6 \mathcal{P} \mathcal{L}_1 \rightarrow \mathcal{L}_6 \mathcal{L}_1 \sim \mathcal{L}_1 \sim$ ルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ ルスルホニル又は C₁~C₆ハロアルキルスルホニルを表し、n が 2 又は 3 を表すとき、各々

の Y3 は互いに同一であっても、又は相異なっていてもよく、

さらに Y^1 、 Y^2 及び Y^3 のうち、何れか 2 つが隣接する場合には、隣接する 2 つの Y は $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-OCH_2O-$, $-CH_2CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2O-$, $-CH_2CH_2O-$, $-OCH_2CH_2O-$, $-OCH_2CH_2S-$, -OCH=N-, -SCH=N-又は-N (\mathbb{R}^{17}) CH=N-を形成することにより、それぞれの Y が結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよいことを表し、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は \mathbb{R}^{18} によって任意に置換されていてもよく、

PCT/JP02/07833

RIは、水素原子を表し、

 R^3 は、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 R^{21} によって任意に置換された $(C_1 \sim C_8)$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル $(C_3 \sim C_8)$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_8)$ アルキニル、 $(C_1 \sim C_8)$

 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_2 \sim C_6$ シアノアルキル、($C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル) アミノカルボニル($C_1 \sim C_4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、($C_1 \sim C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_4$) アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルアミノスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、($C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル

20

25

アルキル) アミノスルホニル、-CHO、C,~C。アルキルカルボニル、C,~C。ハロアルキルカ ルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル又は C₁~C₆ハロアルコキシカルボニルを表し、

 R^{6a} 及び R^{6b} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニルを表し、

5 \mathbb{R}^{14} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル又は \mathbb{C}_{10} によって置換されていてもよいフェニルを表し、 R^{17} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、

 \mathbb{R}^{18} は、ハロゲン原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル又は \mathbb{C}_{10} によって置換さ れていてもよいフェニルを表し、同時に2個以上のRI®で置換されている場合、各々のRI® は互いに同一であっても、または相異なっていてもよく、

R²¹は、ハロゲン原子、シアノ、C₃~C₆シクロアルキル、-OH、-OR^{8c}、-SH、-S (0) -R²⁹、 10 -N(R⁹)R^{8c}、-CHO、C₁~C₆アルキルカルボニル、(Z)_{n1}によって置換されていてもよいフェニ ルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、-C (0) N (R¹¹) R¹⁰、-CH=NOR¹²、-C (R¹⁰) =NOR¹²、 (Z)」によって置換されていてもよいフェニル、L又はMを表し、

 \mathbb{R}^{8c} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ C_6 アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-C(0) R^{10}$ 、 $-C(0) OR^{10}$ 、 $-C(0) N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-C(S) N(R^{11}) R^{10}$ 、 $-S(0) {}_{2}R^{10}$ 、

-S (0) N (R^{II}) R^{IO}、-P (0) (OR^{I3}) 、-P (S) (OR^{I3}) 又は (Z) によって置換されていてもよいフェ ニルを表し、

 \mathbb{R}^{10} は、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ アルコキシ ($\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_4$) アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ C_6 アルキルチオ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $(Z)_{n_1}$ によって置換されていてもよいフェニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、C₂~C₆アルケニル、(Z)_nによって置換されていてもよ いフェニル、L又はMを表し、

R^{||}は、水素原子又は C₁~C₆アルキルを表すか、或いは、R^{|0}と R^{|1}とが一緒になって C₂ ~C₅アルキレン鎖を形成することにより、結合する窒素原子と共に3~6員環を形成し てもよいことを表し、このときこのアルキレン鎖は酸素原子及び硫黄原子から選ばれる 1個の原子を含んでもよく、且つ C₁~C₈アルキル基によって置換されていてもよく、

 \mathbb{R}^{12} は、水素原子、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ アルキル、 $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_6$ ハロアルキル、 $\mathbb{C}_3 \sim \mathbb{C}_8$ シクロアルキル $\mathbb{C}_1 \sim \mathbb{C}_8$ C_{4}) PN+N, $C_{1}\sim C_{4}$ $PN-1+\nu$ ($C_{1}\sim C_{4}$) PN+N, $C_{1}\sim C_{4}$ $PN+N+\nu$, $C_1 \sim C_4$ アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、ジ $(C_1 \sim C_4)$ アルキル)アミノカルボニル $(C_1 \sim C_4)$ アルキル)

WO 03/011028 PCT/JP02/07833

291

 \sim C₄) アルキル、(Z) $_{p_1}$ によって置換されていてもよいフェニル (C $_1$ \sim C₄) アルキル又は C $_3$ \sim C $_6$ アルケニルを表し、

 R^{29} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{31} によって任意に置換された ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 (Z) $_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルチオ、-C (0) R^{10} 、-C (0) N (R^{11}) R^{10} 、

-C (S) N (\mathbb{R}^{11}) \mathbb{R}^{10} 、(\mathbb{Z}) $_{pl}$ によって置換されていてもよいフェニル、L-21、L-32、L-33、L-35、L-45、L-48 又は L-49 を表し、

 R^{31} は、ハロゲン原子、-OH、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノカルボニル又は $(Z)_{p1}$ によって置換されていてもよいフェニルを表す請求の範囲第7項記載の置換アミド化合物又はその塩。

10. 請求の範囲第4項ないし第9項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする有害生物防除剤。

15

20

- 11. 請求の範囲第4項ないし第9項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする農薬。
- 12. 請求の範囲第4項ないし第9項記載の置換アミド化合物及びその塩から選ばれる1種又は2種以上を有効成分として含有することを特徴とする殺虫剤又は殺ダニ剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP02/07833

A 67 46					
A. CLAS	SIFICATION OF SUBJECT MATTER .C1 ⁷ A01N37/30, 37/52, 43/44, 257/06, C07D239/88, 263/1	43/48, 43/54, C07C237/4 0, 265/08	0, 237/42,		
	According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC				
	OS SEARCHED				
Int	documentation searched (classification system followed). C1 ⁷ A01N37/30, 37/52, 43/44, 257/06, C07D239/88, 263/1	43/48, 43/54, C07C237/40 0, 265/08			
	tion searched other than minimum documentation to the				
Electronic o	data base consulted during the international search (nar LUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY	ne of data base and, where practicable, sea (STN)	rch terms used)		
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	***			
Category*	Citation of document, with indication, where a	ppropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.		
P,X	WO 02/48137 A2 (E.I. Du Pont 20 June, 2002 (20.06.02), Claims (Family: none)	de Nemours & Co.),	1-3		
P,X	WO 01/70671 A2 (E.I. Du Pont 27 September, 2001 (27.09.01 Claims; examples (for example page 173) & AU 200150946 A),	1-4,10-12		
A		.308	1-12		
Furth	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.			
"A" docum conside arlier date docum cited to special docum means "P" docum than the Date of the a	categories of cited documents: ent defining the general state of the art which is not red to be of particular relevance document but published on or after the international filing ent which may throw doubts on priority claim(s) or which is establish the publication date of another citation or other reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or other ent published prior to the international filing date but later e priority date claimed actual completion of the international search cctober, 2002 (24.10.02)	"T" later document published after the interpriority date and not in conflict with the understand the principle or theory under document of particular relevance; the considered novel or cannot be considered step when the document is taken alone document of particular relevance; the considered to involve an inventive step combined with one or more other such combination being obvious to a person document member of the same patent for the same patent of the same patent of the same patent for the same patent of the same pat	e application but cited to orlying the invention cannot be red to involve an inventive claimed invention cannot be when the document is documents, such skilled in the art amily		
	ailing address of the ISA/	Authorized officer			
Japa	nese Patent Office		·		
Facsimile No.		Telephone No.			

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07833

_	ervations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This internati	onal search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
ı	ims Nos.: ause they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
beca	ims Nos.: ause they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an ent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. Clai	ims Nos.:
	ause they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
	ervations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)
Ins having ins publicl claim 1 cases w which d Sinc use and formula	conal Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows: secticides containing as the active ingredient substituted amides basic skeletons represented by the general formula (1) in claim 1 are by known (see EP 919542 A2 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 1999.06.02). Thus, discloses at least six inventions resulting from combinations of three therein G is G-1, G-2, or G-3 by two cases wherein X¹ is X¹-1 or X¹-2, to not form a single general inventive concept. The claims 2-12 relate respectively to compounds of claim 1 limited in specific ones of the substituted amides represented by the general (1) in claim 1, claims 1-12 also involve six inventions which do not (continued to extra sheet)
1. As a	Ill required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable ns.
	Il searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment my additional fee.
	only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
restri	equired additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is icted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: $1-12$ is relating to compounds of the general formula (1) wherein G is G-1 is X^1-1 .
Remark on Pr	The additional search fees were accompanied by the applicant's protest. No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

	PCT/JP02/07833
Continuation of Box No.II of continuation of	
form a single general inventive concept, as lo six inventions which do not form a single gene	ong as claim 1 contains eral inventive concept.
	,
	·

Form PCT/ISA/210 (extra sheet) (July 1998)

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC)) Int. Cl. ⁷ A01N37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40, 237/42, 257/06, C07D239/88, 263/10, 265/08				
B. 調査を行				
	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·			
Int. Cl. 7 A01	LN37/30, 37/52, 43/44, 43/48, 43/54, C07C237/40,	237/42, 257/06, C07D239/88, 263/10, 265/	′08	
最小限資料以外	トの資料で調査を行った分野に含まれるもの			
国際調査で使用	目した電子データベース(データベースの名称、	調査に使用した用語)		
CAP	LUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)			
C. 関連する				
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連すると	ときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号	
PX	WO 02/48137 A2(E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 1-3 2002.06.20 特許請求の範囲(ファミリーなし)			
PX	WO 01/70671 A2(E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2001.09.27 特許請求の範囲,実施例(例えば、第173頁化合物199等) &AU 200150946 A			
A	EP 1006107 A2(NIHON NOHYAKU CO., LTD.) 2000.06.07 1-12 特許請求の範囲,第32頁表1No.308 &AU 9961790 A &CZ 9904099 A3 &ZA 9907318 A &CN 1255491 A			
図 C欄の続き	さにも文献が列挙されている。	□ パテントファミリーに関する別	紙を参照。	
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表された文献であって、追願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理じのとなったもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願 「&」同一パテントファミリー文献			発明の原理又は理論 当該文献のみで発明 えられるもの 当該文献と他の1以 当明である組合せに	
国際調査を完了した日 24.10.02 国際調査報告の発達		国際調査報告の発送日 19.	11.02	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁(ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号		特許庁審査官(権限のある職員) 爾見 武志 (1)印 電話番号 03-3581-1101	内線 3443	

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP02/07833

C(続き).	関連すると認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
	&KR 2000035763 A &JP 2001-131141 A &BR 9905766 A &HU 9904444 A2	
	·	

国際出願番号 PCT/JP02/07833

第 I 欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見(第 1 ページの 2 の続き)
法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。
1.
2. 請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に 従って記載されていない。
第Ⅱ欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)
次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。
請求の範囲1に記載された一般式(1)で表される基本骨格を有する置換アミド化合物を有効成分として含有する殺虫剤は公知である(EP 919542 A2(NIHON NOHYAKU CO.,LTD.) 1999.06.02参照)。よって、請求の範囲1には、少なくとも、GがG-1、G-2、G-3の3通りであるものと、 X^1 が X^1 -1、 X^1 -2の2通りであるものとの組み合わせからなる、 $3\times2=6$ 個の単一の一般的発明概念を形成しない発明が記載されている。請求の範囲2-12は、請求の範囲1の用途を限定したものに関する発明、あるいは請求の範囲1の一般式(1)で表される置換アミド化合物を限定したものに関する発明であるから、請求の範囲1に単一の一般的発明概念を形成しない6発明が存在する以上、請求の範囲1-12においても、単一の一般的発明概念を形成しない6発明が存在する。
1. 出題人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求 の範囲について作成した。
2. □ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. X 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。
請求の範囲 $1-1$ 2 において、一般式(1)で表される化合物のうち、 G が $G-1$ 、かつ X^1 が X^1-1 である化合物に関する部分。
追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

様式PCT/ISA/210 (第1ページの続葉 (1)) (1998年7月)